



(i) Veröffentlichungsnummer: 0 336 354 B1

(12)

EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT

- 45 Veröffentlichungstag der Patentschrift: 02.11.94
- (21) Anmeldenummer: 89105861.2
- 2 Anmeldetag: 04.04.89

Die Akte enthält technische Angaben, die nach dem Eingang der Anmeldung eingereicht wurden und die nicht in dieser Patentschrift enthalten sind. (5) Int. Cl.5: **CO7D** 239/42, CO7D 239/52, C07D 249/14, C07D 251/46. C07D 471/04, C07D 487/04, A01N 47/36

- Heterocyclisch substituierte Alkyl- und Alkenylsulfonylharnstoffe, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.
- Priorität: 08.04.88 DE 3811777
- 43 Veröffentlichungstag der Anmeldung: 11.10.89 Patentblatt 89/41
- 45 Bekanntmachung des Hinweises auf die Patenterteilung: 02.11.94 Patentblatt 94/44
- Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE ES FR GB IT LI NL SE
- (56) Entgegenhaltungen:

EP-A- 0 061 661

EP-A- 0 071 958

EP-A- 0 085 236

EP-A- 0 117 014

EP-A- 0 139 947

73 Patentinhaber: Hoechst Schering AgrEvo **GmbH**

Gerichtstrasse 27 D-13342 Berlin (DE)

Erfinder: Willms, Lothar, Dr.

Schulstrasse 3

D-5416 Hillscheid (DE)

Erfinder: Bauer, Klaus, Dr.

Doorner Strasse 53D

D-6450 Hanau (DE)

Erfinder: Bieringer, Hermann, Dr.

Eichenweg 26

D-6239 Eppstein/Taunus (DE)

Erfinder: Bürstell, Helmut, Dr.

Am Hohlacker 65

D-6000 Frankfurt am Main 50 (DE)

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).

Beschr ibung

Es ist bekannt, daß heterocyclisch substituierte Alk(en)ylsulfonylharnstoffe herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Eigenschaften aufweisen (s. EP-A 061,661; EP-A 071,958; EP-A 085,236; EP-A 0,139,947). Diese weisen jedoch zum Teil bei ihrer Anwendung Nachteile auf, wie beispielsweise eine hohe Persistenz oder unzureichende Selektivität in wichtigen Nutzkulturen.

Es wurden nun neue heterocyclische Sulfonylharnstoffe mit vorteilhaften herbiziden Eigenschaften gefunden.

Gegenstand der vorliegende Erfindung sind daher die Verbindungen der Formel (I) oder deren Stereoisomere

worin

R1 =

15

20

25

30

A = einen Rest der Formel > $C(R^4)_2$ oder > $C = C(R^5)_2$,

H, (C₁-C₈)Alkyl, (C₂-C₈)Alkenyl, (C₂-C₈)Alkinyl, wobei diese aliphatischen Reste ein- oder mehrfach durch Halogen, oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₂-C₆)Alkenyloxy, (C₂-C₆)Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl oder durch Phenyl substituiert sein können; (C₃-C₈)Cycloalkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkoxy oder (C₁-C₄)Alkylthio substituiert sein kann; (C₅-C₈)Cycloalkenyl, Cyclopropylmethyl, Epoxypropyl, Furfuryl, Tetrahydrofurfuryl, Phenoxy(C₁-C₆)alkyl oder Phenyl, die beide im Phenyl-Ring durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy oder NO₂ substituiert sein können,

 $R^2 = H$, $(C_1-C_8)Alkyl$, $(C_2-C_8)Alkenyl$, $(C_2-C_8)Alkinyl$ oder $(C_1-C_4)Alkoxy$,

R³ = einen Rest der Formel

50

55

 $R^4 =$

unabhängig voneinander H, $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_3-C_8)Cycloalkyl$, wobei die vorgenannten C-haltigen Reste ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- oder zweifach durch $(C_1-C_6)Alkoxy$, $(C_2-C_6)Alkenyloxy$, $(C_2-C_6)Alkinyloxy$, $(C_1-C_6)Alkylsulfinyl$, $(C_1-C_6)Alkylsulfinyl$, $(C_1-C_6)Alkylsulfonyl$ oder $(C_1-C_6)Alkoxycarbonyl$ oder durch Phenyl, das ein-oder mehrfach durch Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkyl$, das ein- oder mehrfach durch Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl$,

R⁵ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₆)Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen oder einoder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₆)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, oder (C₁-C₆)Alkoxycarbonyl substituiert sein kann oder einer der Reste R⁵ Phenyl, das ein- oder mehrfach
durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, NO₂, CF₃ oder (C₁-C₆)Alkoxycarbonyl substituiert
sein kann, oder beide Reste R⁵ gemeinsam einen Alkylenrest -(CH₂)_n-,

R⁶ = unabhängig voneinander H, Halogen, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy oder (C₁-C₆)Alkylthio, die ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkoxy oder (C₁-C₄)-Alkylthio substituiert sein können; einen Rest N(R¹¹)₂, (C₃-C₅)Cycloalkyl, -OCHR⁷COOR¹¹, (C₃-C₅)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkinyl, (C₃-C₅)Alkenyloxy oder (C₃-C₅)Alkinyloxy,

10 $R^7 = H \text{ oder } (C_1-C_4)Alkyl,$

 $R^8 = (C_1-C_4)AlkyI, -CHF_2 \text{ oder } -CH_2CF_3,$

R⁹ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy oder Halogen,

 R^{10} = H, $(C_1-C_4)AlkyI$, $-CHF_2$ oder $-CH_2CF_3$,

R¹¹ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₄)Alkyl, (C₂-C₄)Alkenyl oder (C₃-C₄)Alkinyl,

15 E = CH oder N,

 $G = CH_2 \text{ oder } O$,

X = 0, S oder NR^{12} ,

Y = O oder S,

 R^{12} = H, (C_1-C_6) Alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_6) Alkoxy, oder einen Rest der Formel

-N (CH2), Z

25

30

20

5

n = eine ganze Zahl von 3 bis 6,

p = eine ganze Zahl von 1 bis 3,

q = eine ganze Zahl von 0 bis 3 und

Z = O, S, CH₂, NH oder N(C₁-C₄-Alkyl) bedeuten, oder deren für die Landwirtschaft einsetzbaren Salze.

Die Verbindungen der Formel I können Salze bilden, bei denen der Wasserstoff der -SO₂-NH-Gruppe durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird. Diese Salze sind im allgemeinen Metall-, insbesondere Alkali-, Erdalkali-, (gegebenenfalls alkylierte) Ammonium- oder organische Aminsalze. Sie werden vorzugsweise in inerten Lösungsmitteln wie z.B. Wasser, Methanol oder Aceton bei Temperaturen von 0-100 °C aus den Verbindungen der Formel I hergestellt. Geeignete Basen zur Herstellung der erfindungsgemäßen Salze sind beispielsweise Alkalicarbonate, wie Kaliumcarbonat, Alkali- und Erdalkalihydroxide, Ammoniak oder Ethanolamin.

Bevorzugte Verbindungen der Formel I sind solche, bei denen

A einen Rest $> C(R^4)_2$ oder $> C = C(R^5)_2$,

R¹ (C₁-C₄)Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- bis zweifach durch (C₁-C₄)Alkoxy substituiert sein kann, insbesondere (C₁-C₄)Alkyl,

45 R² H, (C₁-C₄)Alkyl oder Allyl, insbesondere H,

R³ einen Rest der Formel

N R6

50

55

R⁴

unabhängig voneinander H oder (C₁-C₆)Alkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- bis zweifach durch (C₁-C₄)Alkoxy oder (C₁-C₄)Alkylthio substituiert sein kann, oder ein Rest R⁴ (C₂-C₆)Alkenyl oder Phenyl, das wie oben angegeben substituiert sein kann; insbesondere steht ein Rest R⁴ für (C₁-C₄)Alkyl oder Phenyl, das ein- bis dreifach durch Fluor,

Chlor, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkyl$ oder Nitro substituiert ist, und der andere Rest R^4 für Wasserstoff,

- R^5 unabhängig voneinander H oder (C_1 - C_6)Alkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiert sein kann,
- R⁶ unabhängig voneinander Halogen, (C₁-C₄)Alkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy, die beide halogeniert sein können, insbesondere die Reste CH₃, OCH₃, OC₂H₅, CI, OCF₂H,
 - E CH oder N,

5

10

20

25

35

40

45

- X O, S oder NR¹²,
- Y O oder S und
- R¹² H, (C₁-C₄)Alkyl oder (C₂-C₄)Alkenyl bedeuten.

Halogen bedeutet insbesondere F, CI oder Br. Halogeniertes (C₁-C₄)Alkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy bedeuten insbesondere CF₃, CHF₂, CH₂CH₂CI, CH₂CH₂Br, CF₂CFCIH, CH₂CF₃, CH₂CCI₃, CF₂CHF₂, CF₂CHFCF₃, CH₂CH₂CI, OCF₃, OCF₂H, OCH₂CF₃, OCH₂CH₂CI.

Ein weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I)oder deren Salze, dadurch gekennzeichnet, daß man

(a) eine Verbindung der Formel (II)

wobei A, X, Y, R¹ die oben angegebene Bedeutung haben, mit der Ausnahme, daß R¹ ≠ H und X ≠ NH sind, mit einer Verbindung der Formel (III)

$$\begin{array}{ccc}
H-N-R^2 & (III) \\
R3 & \end{array}$$

umsetzt,

(b) eine Verbindung der Formel (IV)

mit einem (Thio)-Carbamat der Formel (V)

$$R^{13} = 0 - C - N - R^2$$
 (V)

wobei R^{13} (C_1 - C_6)Alkyl, (C_1 - C_4)Halogenalkyl oder Phenyl bedeutet, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C_1 - C_4)Alkyl, oder NO₂ substituiert sein kann, umsetzt,

55

(c) ein (Thio)-Carbamat der Formel (VI) mit einer Verbindung der Formel (III)

wobei R¹³ die oben angegebene Bedeutung hat, umsetzt oder (d) eine Carbonsäure der Formel (VII)

mit einem Alkylierungsreagens der Formel (VIII)

R1-X (VIII)

5

10

20

25

30

50

55

wobei X für eine nucleofuge Abgangsgruppe wie z.B. Halogen, Alkyl-SO₂-O- oder Tosyl steht, umsetzt und die erhaltenen Verbindungen gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

Die Umsetzung der Verbindungen der Formeln (II) und (III) erfolgt vorzugsweise in inerten aprotischen Lösungsmitteln, wie z.B. Acetonitril, Dichlormethan, Toluol, Tetrahydrofuran oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 0 °C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels.

Die Alkylsulfonyliso-(thio)-cyanate der Formel (II) lassen sich nach im Prinzip bekannten Verfahren aus den entsprechenden Sulfonamiden der Formel (IX) in einfacher Weise herstellen

40 (vgl. z.B. EP-A 085,276).

Die Sulfonamide der Formel (IX) sind bekannt oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Verfahren herstellen, z.B. durch Umsetzung aliphatischer α-Chlorsulfonylcarbonsäureester mit Ammoniak (Bull. Soc. Chim. France 1975, 807).

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind bekannt oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Verfahren herstellen, z.B. durch Cyclisierung entsprechender Guanidinderivate mit entsprechend substituierten 1,3-Diketonen, vergleiche z.B. "The Chemistry of Heterocyclic Compounds", Vol. XVI (1962) and Supplement I (1970), oder durch Derivatisierung von Cyanurchlorid, vgl. z.B. "The Chemistry of Heterocyclic Compounds", L. Rapaport: "s-Triazines and Derivates" (1959).

Die Umsetzung der Verbindung (IV) mit den heterocyclischen Carbamaten der Formel (V) wird vorzugsweise in Gegenwart von tertiären organischen Basen wie z.B. 1,8-Diazabicyclo-5,4,0-undec-7-en (DBU) in inerten Lösungsmitteln wie Acetonitril oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 20 °C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels durchgeführt (analog EP-A 44 807).

Die hierzu erforderlichen Carbamate (V) sind literaturbekannt oder werden nach bekannten Verfahren hergestellt (EP A 70 804).

Die Carbamate der Formel (VI) sind neu und lassen sich durch Umsetzung der Verbindungen der Formel (IX) mit entsprechenden Chlorameisensäureestern herstellen (s. EP-A 87 780).

Die Umsetzung der (Thio)-Carbamate (VI) mit den Aminoheterocyclen führt man vorzugsweise in inerten Lösungsmitteln wie z.B. Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dioxan oder Acetonitril bei Temperaturen zwischen 20

*C und der Siedetemperatur des betreffenden Lösungsmittels durch.

Die Umsetzung der Carbonsäuren (VII) mit den Reagentien der Formel (VIII) wird in inerten Lösungsmitteln wie z.B. Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid, vorzugsweise in Gegenwart einer Hilfsbase wie z.B. Triethylamin oder Tetramethylammoniumhydroxidpentahydrat, bei Temperaturen zwischen 0 °C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels durchgeführt.

Die Sulfonylharnstoffe der Formel I, welche im aliphatischen Rest A ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome enthalten, liegen in enantiomeren oder diastereomeren Formen vor. Im allgemeinen werden die entsprechenden erfindungsgemäßen Verbindungen als Racemate oder als Diastereomerengemische erhalten. Falls gewünscht, können die üblichen Techniken zur Trennung dieser Gemische in die sterisch einheitlichen Bestandteile angewendet werden. Auch durch Verwendung von sterisch einheitlichen Ausgangsmaterialien ist eine Reindarstellung der genannten Verbindungen möglich.

Ferner können Sulfonylharnstoffe der Formel I, welche im aliphatischen Rest A eine oder mehrere Doppelbindungen enthalten, bei entsprechender olefinischer Substitution als E- oder als Z-Isomere vorkommen, deren Reindarstellung oder Trennung ebenfalls möglich ist. Werden z.B. ungesättigte Sulfonylisocyanate der allgemeinen Formel II als E- oder Z-Isomere eingesetzt, so werden die ungesättigten Sulfonylharnstoffe der Formel I in sterisch einheitlicher Form erhalten.

Die Formel I umfaßt daher alle obengenannten enantiomeren und diastereomeren Formen der oben definierten Verbindungen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöckchen oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Vorauflaufoder Nachauflaufverfahren ausgebracht werden. Im Einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrauftflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z.B. Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria etc. sowie Cyperusarten aus der annuellen Gruppe und auf seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum etc. und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt. Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon, Sida etc. auf der annuellen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex, Artemisia etc. bei den perennierenden Unkräutern.

Unter den spezifischen Kulturbedingungen im Reis vorkommende Unkräuter wie z.B. Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus, Cyperus etc. werden von den erfindungsgemäßen Wirkstoffen ebenfalls hervorragend bekämpft.

Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert, oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstop ein, und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wuchsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit mehr oder weniger schnell ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig durch den Einsatz der neuen erfindungsgemäßen Mittel beseitigt werden kann.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie z.B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen.

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch ein Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die landwirtschaftlich oder industriell genutzten Böden eine wirksame Menge einer erfindungsgemäßen Verbindung der Formel I oder deren Stereoisomeren oder deren Salz appliziert.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeneigenen Stoffwechsel ein und können damit zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation, Abszission und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Des weiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert

oder völlig verhindert werden kann.

25

45

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch ein Verfahren zur Wachstumsregulation von Nutzpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die Anbaufläche eine wirksame Menge einer erfindungsgemäßen Verbindung der Formel I oder deren Stereoisomeren oder deren Salz appliziert. Gegenstand der Erfindung sind auch herbizide oder pflanzenwachstumsregulatorische Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine wirksame Menge einer Verbindung der Formel I oder deren Stereoisomer oder deren Salz und inerte Hilfsstoffe enthalten. Die erfindungsgemäßen Mittel können als Spritzpulver, emulgierbare Konzentrate, Emulsionen, versprühbare Lösungen, Stäubemittel, Beizmittel, Dispersionen, Granulate oder Mikrogranulate in den üblichen Zubereitungen angewendet werden.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer gegebenenfalls einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z.B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenylsulfonate und Dispergiermittel, z.B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'disulfonsaures Natrium, dibutylnaphthalinsulfonsaures Natrium oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Die Herstellung erfolgt in üblicher Weise, z.B. durch Mahlen und Vermischen der Komponenten.

Emulgierbare Konzentrate können z.B. durch Auflösen des Wirkstoffes in einem inerten organischen Lösungsmittel, z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt werden. Bei flüssigen Wirkstoffen kann der Lösungsmittelanteil auch ganz oder teilweise entfallen. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calciumsalze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkyl-arylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Fettalkohol-Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyglykolether, Sorbitanfettsäureester, Polyoxethylensorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

Stäubemittel kann man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit feinverteilten, festen Stoffen z.B. Talkum, natürlichen Tonen wie Kaolin, Bentonit, Pyrophillit oder Diatomeenerde erhalten.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten, mittels Bindemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise, gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln, granuliert werden.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-%, versprühbare Lösungen etwa 2 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstofformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Diese oben genannten Formulierungstypen werden beispielsweise beschrieben in:

Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die für diese Formulierungen zu verwendenden Formulierungshilfsmittel (Inertmaterialien, Emulgatoren, Netzmittel, Tenside, Lösungsmittel etc.) sind beispielsweise in Marschen, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood oder "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964 beschrieben.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubförmige und granulierte Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,005 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,01 und 5 kg/ha.

Auch Mischungen oder Mischformulierungen mit anderen Wirkstoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Düngemitteln, Wachstumsregulatoren oder Fungiziden sind gegebenenfalls möglich.

Die Erfindung wird durch nachstehende Beispiele näher erläutert.

Formulierungsbeispiel

- A. Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gewichtsteile Wirkstoff und 90 Gewichtsteile Talkum oder Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
 - B. Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile Wirkstoff, 64 Gewichtsteile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gewichtsteil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
 - C. Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gewichtsteile Wirkstoff mit 6 Gewichtsteilen Alkylphenolpolyglykolether (® Triton X 207), 3 Gewichtsteilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gewichtsteilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 377 °C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- D. Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gewichtsteilen Wirkstoff, 75 Gewichtsteilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gewichtsteilen oxethyliertes Nonylphenol (10 EO) als Emulgator.

Chemische Beispiele

20 Beispiel 1:

10

D,L-N-[4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-(1-ethoxycarbonyl-eth-1-yl)sulfonamid

8,54 g (0,03 Mol) O-phenyl-N-(4,6-dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-carbamat und 5,44 g (0,03 Mol) D,L-Ethyl-2-aminosulfonylpropanoat (hergestellt nach J. Org. Chem. 43, S. 4535 (1978)) werden in 200 ml Acetonitril suspendiert und bei 20 °C mit 5,02 g (0,033 Mol) DBU (DBU = 1,8-Diazabicyclo-5,4,0-undec-7-en) versetzt. Nach 1 h Rühren bei 20 °C wird das Reaktionsgemisch auf ca. 50 ml eingeengt, mit 200 ml Eiswasser versetzt und mit 2n HCl ein pH-Wert von ca. 3,5-4,5 eingestellt. Nach Absaugen des Reaktionsproduktes und Umkristallisieren aus Essigester/n-Hexan erhält man 10,2 g (94 % d. Th.) D,L-N-[4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-aminocarbonyl]-(1-ethoxycarbonyl-eth-1-yl)sulfonamid vom Schmelzpunkt 131-133 °C.

Beispiel 2:

40

45

50

55

35 D-N-[4,6-Dimethyl-pyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-(1-ethoxycarbonyl-eth-1-yl)sulfonamid

a) D-2-(tert. Butylaminosulfonyl)propionsäureethylester

22,8 g (0,2 mol) Benzylmercaptan werden in 500 ml wasserfreien Acetonitril gelöst und bei 0 °C mit 9,6 g (0,2 mol) NaH (50 %ig) langsam versetzt. Anschließend wird 2 h bei 25 °C nachgerührt und bei 0 °C eine Lösung von 21,7 g (0,2 mol) L-2-Chlorpropionsäureethylester in 100 ml Acetonitril zugetropft. Nach 1 h Reaktion bei Raumtemperatur und 2 h bei 60 °C wird das Reaktionsgemisch filtriert, das Lösungsmittel im Vakuum abdestilliert, und das resultierende Öl bei 0 °C in 250 ml Eisessig/200 ml H₂O suspendiert. Anschließend wird das Gemisch bei 0 °C mit Chlor gesättigt, mit Eiswasser verdünnt, mit CH₂Cl₂ extrahiert und die organischen Extrakte über Na₂SO₄ getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels im Vakuum erhält man ein viskoses Öl, welches in CH₂Cl₂ gelöst und mit 29,2 g (0,4 mol) tert. Butylamin bei 0 °C umgesetzt wird. Nach 1 h Reaktion bei Raumtemperatur wird mit Eiswasser verdünnt und anschließend das Sulfonamid mit CH₂Cl₂ extrahiert. Nach Trocknen über Na₂SO₄ und Eindampfen des Lösungsmittels wird der Rückstand im Hochvakuum destilliert. Man erhält 37,9 g (85 %) an D-2-(tert. Butylaminosulfonyl)-propionsäureethylester vom Schmp. 75-76 °C (ee ca. 92 %)

b) D-2-(Aminosulfonyl)propionsäureethylester

23,7 g (0,1 Mol) D-2-(tert.Butylaminosulfonyl)propionsäureethylester (Beispiel 2a) werden zu 100 ml Trifluoressigsäure gegeben und ca. 1 h unter Rückfluß erhitzt. Anschließend wird im Hochvakuum eingeengt und der Rückstand aus Isopropanol umkristallisiert. Man erhält 17,5 g (97 % d. Th.) an D-2-(Aminosulfonyl)propionsäureethylester vom Schmp. 72-74 °C.

c) D-2-[(n-Butylaminocarbonyl)aminosulfonyl]propionsäure ethylester 18,13 g (0,1 Mol) D-2-(Aminosulfonyl)propionsäureethylester wurden in 300 ml Aceton gelöst und nach Zugabe von 10,59 g (0,12 Mol) K₂CO₃ 30 min bei 50 °C gerührt. Anschließend werden bei

Raumtemperatur 11,9 g (0,1 Mol) n-Butylisocyanat zugetropft; die Suspension wird 5 h bei 50 °C gerührt. Nach dem Abdestillieren des Lösungsmittels wird der verbleibende Rückstand in Wasser gelöst, filtriert und das Filtrat bei 0 °C angesäuert. Nach Absaugen und Trocknen erhält man 23,8 g (85 % d. Th.) an D-2-[(n-Butylaminocarbonyl)aminosulfonyl]propionsäureethylester vom Schmp. 66-68 °C.

d) D-(1-Ethoxycarbonyl-eth-1-yl)sulfonylisocyanat

- 19,63 g (0,07 Mol) D-2-[(n-Butylaminocarbonyl)aminosulfonyl]propionsäureethylester von Beispiel 2c werden in 150 ml Xylol suspendiert; anschließend werden bei 130 °C ca. 2 h Phosgen eingeleitet. Nach dem Abdestillieren des Lösungsmittels erhält man das gewünschte Sulfonylisocyanat in quantitativer Ausbeute (14,5 g), IR: NCO-Bande bei 2323 cm⁻¹).
- e) D-N-[(4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-(1-ethoxycarbonyl-eth-1-yl)sulfonamid
 3,1 g (0,02 Mol) 2-Amino-4,6-dimethoxy-pyrimidin werden in 50 ml CH₂ Cl₂ gelöst und bei 0 °C mit 4,67 g (0,0225 Mol) D-(1-Ethoxycarbonyl-eth-1-yl)sulfonylisocyanat versetzt. Nach 2 h Rühren bei Raumtemperatur wird das Lösungsmittel abdestilliert und das zurückbleibende Produkt aus Essigester/n-Hexan umkristallisiert. Man erhält 6,92 g (96 % d. Th.) an D-N-[(4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)aminocarbonyl] (1-ethoxycarbonyl-eth-1-yl)sulfonamid vom Schmp. 134-136 °C.

Beispiel 3:

2-{N-[N-4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-aminocarbonyl}-aminosulfonyl}-3-phenyl-prop-2-en-säureethylester

20

25

30

35

- a) 3-Phenyl-2-(tert.butylaminosulfonyl)-prop-2-en-säureethylester
- 11,2 g (0,05 Mol) 2-(tert.Butylaminosulfonyl)essigsäureethylester (s. J. Org. Chem. 43, S. 4535 (1978)) werden in 50 ml Benzaldehyd gelöst, mit 2 g Ammoniumacetat und 2 ml Eisessig versetzt und 2 h bei 60 °C im Wasserstrahlvakuum (20 mm) gerührt. Anschließend wird der überschüssige Aldehyd abdestilliert, der Rückstand mit n-Hexan digeriert und aus Isopropanol umkristallisiert. Man erhält 11,2 g (72 % d. Th.) 3-Phenyl-2-(tert.butylaminosulfonyl)-prop-2-en-säureethylester vom Schmp. 111-113 °C.
- b) 3-Phenyl-2-aminosulfonyl-prop-2-en-säureethylester
- 6,23 g (0,02 Mol) 3-Phenyl-2-(tert.butylaminosulfonyl)-prop-2-en-säureethylester (Beispiel 3a) werden in 50 ml Trifluoressigsäure 1 h erhitzt. Nach Aufarbeitung analog Beispiel 2b) erhält man 4,1 g 3-Phenyl-2-aminosulfonyl-prop-2-en-säureethylester vom Schmp. 88-89 °C.
- c) 2-{N-[N-(4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-aminocarbonyl}-aminosulfonyl}-3-phenyl-prop-2-en-säureeth-ylester
- 5,10 g (0,02 Mol) (3-Phenyl-2-aminosulfonyl)-prop-2-en-carbonsäureethylester von Beispiel 3b) werden analog Beispiel 1 mit 0-Phenyl-N-(4,6-dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-carbamat umgesetzt. Man erhält 7,41 g (85 % d. Th.) an 2-{N-[N-(4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-aminocarbonyl]-aminosulfonyl}-3-phenyl-prop-2-en-säureethylester vom Schmp. 140-143 °C.

Analog der in Beispiel 1 bis 3 beschriebenen Verfahren werden die in Tabelle 1 bis 3 aufgeführten Verbindungen hergestellt.

40

45

50

EP 0 336 354 B1

5	Bsp. Nr.	A	XR ¹	R ²	R ⁶	_R 6'	E	Fp
	16	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	СН3	СН3	СН	170
10	17	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	осн3	сн3	СН	
	18	CH ₂	oc ₂ н ₅	Н	осн3	осн3	CH	
15	19	CH ₂	oc ₂ н ₅	сн3	och ₃	OCH ₃	СН	
	20	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	Cl	СН	
20	21	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	NHCH ₃	СН	
	22	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	Br	СН	
25	23	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	осн3	SCH3	СН	
	24	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	ochf ₂	осн3	СН	
30	25	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	сн3	N	
	26	CH ₂	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	NHCH ₃	N	

35 27 CH₂ OC₂H₅ H OCH₃ N(CH₃)₂ N

EP 0 336 354 B1

5	Bsp.	A	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
10	28	Сн3-Сн	осн3	н	CH ₃	сн3	СН	136-138
	29	сн3-сн	OCH ₃	н	осн ₃	сн3	СН	
15	30	СН3-СН	осн3	н	осн ₃	осн3	СН	
20	31	сн3-сн	OCH ₃	сн3	осн3	сн3	СН	
	32	сн3-сн	осн3	н	осн ₃	Cl	СН	128-130
25	33	СН3-СН	осн3	н	ochf ₂	ochf ₂	СН	
30	34	СН3-СН	осн3	Н	scH ₃	сн3	СН	
	35	СН3-СН	осн3	н	CH(OCH ₃) ₂	OCH ₃	СН	
35	36	СН3-СН	осн3	н	осн3	сн3	N	

EP 0 336 354 B1

	Bsp.				•			
5	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	_R 6'	E	Fp
10	37	сн ₃ -сн	осн3	н	осн3	осн ₃	N	
	38	сн ₃₋ сн	OCH ₃	Н	NH ₂	OCH ₃	N	
15	39	сн ₃ -сн	осн3	СНЗ	осн ₃	сн3	N	
20	40 (L)	сн3-сн	OCH ₃	Н	осн ₃	осн ₃	СН	128-132
25	41 (L)	сн3-сн	осн3	Н	осн3	сн3	СН	
20	42 (L)	сн3-сн	осн ₃	н	сн3	CH ₃	СН	
30	43 (L)	сн ₃ -сн	осн3	Н	OCH ₃	сн3	N	
35	44 (D)	сн3-сн	oc ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	СН	
40	4 5 (D)	сн3-сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
	/ T N %		• •					

(L) bedeutet: L-Isomeres

(D) bedeutet: D-Isomeres

50

45

EP 0 336 354 B1

5	Bsp.							
	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	R6'	E	Fp
10	46 (D)	сн3-сн	n-C3H7	Н	осн3	Cl	CH .	148-149
	47	с2н5-сн	осн ₃	н	СН3	СН3	СН	
15	48	С2Н5-СН	OCH ₃	н	CH ₃	OCH ₃	СН	
20	49	С2Н5-СН	осн ₃	н	осн ₃	осн3	СН	138-142
	50	С2Н5-СН	OCH ₃	Н	OCHF ₂	OCHF ₂	СН	
25	51	С2Н5-СН	OCH ₃	н	OCHF ₂	осн3	СН	
30	52	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	OCH ₂ CF ₃	СН	
	53	С2Н5-СН	OCH ₃	н	oc ₂ H ₅	OCH ₂ CF ₃	СН	
35	54	.С2Н5-СН	OCH ₃	н	ос ₂ н ₅	oc ₂ H ₅	СН	
40	55	С2Н5-СН	осн3	н	SCH ₃	СНЗ	СН	
.•	56	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	NHCH ₃	СН	
45	57	с ₂ н ₅ -сн	осн3	н	CH ₃	N(CH ₃) ₂	СН	

50

EP 0 336 354 B1

_	Bsp	
£	עכם.	٠

5	вsр.							
	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	_R 6'	E	Fp
10	58	С2Н5-СН	OCH ₃	н	OCH ₃		СН	
	59	С2Н5-СН	осн3	н	сн3		СН	
15	60	С2Н5-СН	осн3	Н	OCHF ₂	ochf ₂	СН	
20	61	С ₂ н ₅ -сн	осн3	СНЗ	оснз	оснз	СН	
	62	С2Н5-СН	осн3	СНЗ	CH ₃	СН3	СН	
25	63	С2Н5-СН	OCH ₃	н	OCH ₃	OCH ₃	N	
30	64	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	CH ₃	N	118
	65	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	scH ₂	И	
35	66	С2Н5-СН	осн3	н	СН3	сн3	N	
40	67	С2Н5-СН	осн3	Н	oc ₂ H ₅	осн3	N	
	68	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	NHCH ₃	N	
45	69	C ₂ H ₅ -CH	осн3	н	oc ₂ H ₅	NHCH ₃	N	

50

F rtsetzung d r Tab lle 1

5	Bsp.					- •		
	Nr.	A	XR ¹	R ²	R ⁶	R6'	E	Fp
10	70	С2Н5-СН	осн3	н	осн ₃	NHC ₂ H ₅	N	
,0	71	С2Н5-СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	NHC ₂ H ₅	N	
15	72	С2Н5-СН	och ₃	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	
20	73	С2Н5-СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	N(CH ₃) ₂	N	
	74	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	\triangleleft	N	
25	75	С2Н5-СН	осн3	н	осн ₃	OCH ₂ CF ₃	N	
30	76	С2Н5-СН	осн3	н	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	N	
	77	С2Н5-СН	осн3	сн3	осн ₃	СН3	N	78-86
35	78	С2Н5-СН	осн3	СН3	осн3	осн3	N	
40	79	С2Н5-СН	осн3	сн3	осн3	NHCH ₃	N	
	80	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	осн ₃	СН	48-50
45	81	С ₂ н ₅ -сн	осн3	н	осн3	CH ₃	СН	

50

F rtsetzung der Tabell 1

5	Bsp.	A	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	F p
10	82 (D)	С ₂ н ₅ - сн	осн3	н	осн ₃	осн3	СН	142-145
	83 (D)	с2н5-сн	осн3	н	СН3	OCH ₃	СН	
15	84 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	СН3	CH ₃	СН	
20	85 (D)	С2Н5-СН	осн3	Н	och ₃	Cl	СН	
25	86 (D)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	н	ochf ₂	OCHF ₂	СН	
	87 (D)	С2Н5-СН	OCH ₃	н	OCHF ₂	осн ₃	СН	
30	88 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	OCH ₂ CF ₃	СН	
35	89 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	OCH ₂ CF ₃	СН	
40	90 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	ос ₂ н ₅	СН	
	91 (D)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	н	SCH ₃	CH ₃	СН	
45	92 (D)	С2Н5-СН	OCH ₃	н	осн3	N HCH ₃	СН	
50	93 (D)	с2н5-сн	OCH3	н	CH ₃	N(CH ₃) ₂	СН	

Fortsetzung der Tab 11 1

5	Bsp.	A	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
10	94 (D)	С2Н5-СН	OCH ₃	н	осн3	\triangleleft	СН	
	95 (D)	с2н5-сн	осн3	н	CH ₃	$\overline{}$	СН	
15	96 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	ochf ₂	OCHF ₂	СН	
20	97 (D)	С ₂ Н ₅ -СН	осн3	CH ₃	OCH ₃	осн ₃	СН	
25	98 (D)	С2Н5-СН	осн3	сн3	CH ₃	CH ₃	СН	
	99 (D)	с2н5-сн	OCH ₃	н	OCH ₃	осн3	N	
30	100 (D)	с2н5-сн	OCH ₃	Н	осн3	CH ₃	N	
35	101 (D)	с2н5-сн	OCH ₃	Н	OCH ₃	scH ₂	N	
40	102 (D)	с2н5-сн	OCH ₃	Н	CH ₃	сн3	N	
	103 (D)	С2Н5-СН	OCH ₃	Н	oc ₂ H ₅	осн ₃	N	
45	104 (D)	С2Н5-СН	осн3	Н	OCH ₃	инсн3	N .	
50	105 (D)	с2н5-сн	осн ₃	н	oc ₂ H ₅	NHCH ₃	N	

EP 0 336 354 B1

5	Bsp.	A	XR ¹	R ²	_R 6 .	_R 6'	E Fp
10	106 (D)	С2Н5-СН	OCH ₃	н	OCH ₃	NHC ₂ H ₅	N
	107 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	NНС ₂ Н ₅	N
15	108 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	OCH3	N(CH ₃) ₂	N
20	109 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	N(CH ₃) ₂	N
25	110 (D)	С ₂ Н ₅ -СН	осн3	н	och ₃	\triangleleft	N
	111 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	OCH ₂ CF ₃	N
30	112 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	сн3	OCH ₂ CF ₃	N
35	113 (D)	С2Н5-СН	OCH ₃	СН3	осн3	сн3	N
40	114 (D)	С2Н5-СН	осн3	СН3	осн3	och ₃	N
	115 (D)	С2Н5-СН	och ₃	CH ₃	осн3	инсн3	N
45	116 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	осн3	СН
50	117 (D)	С2Н5-СН	осн3	н	осн3	CH ₃	СН

Forts tzung der Tab 11e 1

5	Bsp.							
	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	R6'	E	Fp
10	118 (L)	С ₂ н ₅ - сн	осн3	н	осн3	осн3	СН	
	119 (L)	с2н5-сн	och ₃	н	СН3	осн3	СН	
15	120 (L)	с2н5-сн	OCH ₃	н	сн3	сн3	СН	
20	121 (L)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	н	осн3	Cl	CH	
25	122 (L)	с2н5-сн	осн3	н	ochf ₂	ochf ₂	СН	
00	123 (L)	с2н5-сн	осн3	Н	ochf ₂	осн3	СН	
30	124 (L)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	н	осн ₃	OCH ₂ CF ₃	СН	
35	125 (L)	с2н5-сн	OCH ₃	Н	ос ₂ н ₅	OCH ₂ CF ₃	СН	
40	126 (L)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	Н	oc ₂ H ₅	ос ₂ н ₅	СН	
45	127 (L)	С2Н5-СН	OCH ₃	н	scH ₃	CH ₃	СН	
40	128 (L)	с2н5-сн	OCH ₃	н	осн3	NHCH ₃	CH .	
50	129 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	СН3	N(CH ₃) ₂	СН	

Fortsetzung der Tabelle 1

5	Bsp.							
	Nr.	A	XR ¹	R ²	R ⁶	R6'	E	Fp
10	130 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	осн3		СН	
	131 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	СН3		СН	
15	132 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	ochf ₂	ochf ₂	СН	
20	133 (L)	С2Н5-СН	осн3	СН3	осн3	осн3	СН	
25	134 (L)	с2н5-сн	осн3	СН3	СН3	Сн3	СН	
	135 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	OCH ₃	OCH ₃	N	
30	136 (L)	с2н5-сн	осн3	Н	och ₃	СН3	N	142-144
35	137 (L)	с2н5-сн	осн3	Н	och ₃	scH ₂	N	
40	138 (L)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	н	сн ₃	СН3	N	
	139 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	осн ₃	N	
45	140 (L)	С2Н5-СН	осн3	H	осн ₃	NHCH ₃	N	
50	141 (L)	С ₂ н ₅ -сн	OCH ₃	н	ос ₂ н ₅	NHCH ₃	N	

Fortsetzung d r Tab lle 1

5	Bsp.	A	XR ¹	R ²	R6	_R 6'	E Fp	
10	142 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	осн ₃	NHC ₂ H ₅	N	
	143 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	осн3	н	ос ₂ н ₅	NHC ₂ H ₅	N	
15	144 (L)	С2Н5-СН	осн3	Н	осн ₃	N(CH ₃) ₂	N	
20	145 (L)	С2Н5-СН	осн3	Н	ос ₂ н ₅	N(CH ₃) ₂	N	
25	146 (L)	с2н5-сн	осн3	н	осн3	\triangleleft	N	
	147 (L)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	Н	осн3	OCH ₂ CF ₃	N	
30	148 (L)	с ₂ н ₅ -сн	осн3	Н	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	N	
35	149 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	осн3	СН3	осн ₃	сн3	N	
40	150 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	осн3	CH ₃	осн3	осн3	N	
	151 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	осн3	сн3	осн ₃	NHCH3	N	
4 5	152 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	осн ₃	осн3	СН	
50	153 (L)	С2Н5-СН	осн3	н	осн ₃	CH ₃	СН	

Fortsetzung d r Tab lle 1

5	Bsp.	<u> </u>	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
10	154	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн ₃	СН	102-104
	155	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	CH ₃	осн3	СН	
15	156	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	CH ₃	СН3	СН	
20	157	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	78-83
	158	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	ochf ₂	СН	
25	159	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	ochf ₂	осн3	СН	
30	160	с2н5-сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	OCH ₂ CF ₃	СН	
	161	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	oc ₂ H ₅	OCH ₂ CF ₃	СН	
35	162	с ₂ н ₅ -сн	oc ₂ H ₅	н	oc ₂ H ₅	oc ₂ H ₅	СН	
40	163	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	SCH3	сн3	СН	
	164	с ₂ н ₅ -сн	oc ₂ H ₅	Н	осн3	NHCH ₃	СН	
45	165	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	CH ₃	N(CH ₃) ₂	СН	

50

EP 0 336 354 B1

Bsp.		

	Bsp.							
5	Nr.	A	XR ¹	R ²	R ⁶	R6'	E	Fp
	166	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	\prec	СН	
10	167	С ₂ н ₅ -СН	ос ₂ н ₅	Н	СН3	\triangleleft	СН	
15	168	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	Н	ochf ₂	ochf ₂	СН	
	169	С ₂ н ₅ -Сн	ос ₂ н ₅	сн3	осн3	осн3	СН	
20	170	С ₂ н ₅ -Сн	oc ₂ H ₅	сн3	СН3	СН3	СН	
25	171	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	осн3	N	
30	172	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	н	осн ₃	СН3	N	
30	173	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	SCH ₂	N	
35	174	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	СН3	сн3	N	
40	175	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	ос ₂ н ₅	осн3	N	
	176	С ₂ н ₅ -Сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	инсн3	N	
45	177	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	инсн3	N	

50

F rts tzung d r Tabelle 1

5	Bsp.	A	XR1	p2 ·	R6	_R 6'	E Fp	
10	178	с ₂ н ₅ -сн		, , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	осн ₃	NHC ₂ H ₅	N	
10	179	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	н	oc ₂ H ₅	NHC ₂ H ₅	N	
15	180	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	Н	осн ₃	N(CH ₃) ₂	N	
20	181	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	н	ос ₂ н ₅	N(CH ₃) ₂	N	
	182	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	осн ₃	\triangleleft	N	
25	183	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	OCH ₂ CF ₃	N	
30	184	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	N	
	185	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	сн3	оснз	CH ₃	N	
35	186	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	СН3	осн3	och ₃	N	
40	187	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	сн3	осн3	NHCH3	N	
	188	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
45	189	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	CH ₃	СН	

55

EP 0 336 354 B1

5	Bsp.		,	٠.		6.1		
	Nr.	A	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
10	190 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	OCH3	осн ₃	СН	
	191 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	CH ₃	OCH ₃	СН	
15	192 (L)	С ₂ н ₅ -Сн	ос ₂ н ₅	Н	CH ₃	CH ₃	СН	
20	193 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	Cl	СН	
25	194 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	OCHF ₂	OCHF ₂	СН	
	195 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	ochf ₂	осн ₃	СН	
30	196 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	СН	
35 _	197 (L)	С ₂ н ₅ - сн	oc ₂ H ₅	Н	ос ₂ н ₅	OCH ₂ CF ₃	СН	
40	198 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	ос ₂ н ₅	СН	٠
	199 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	oc ₂ H ₅	Н	SCH ₃	CH ₃	СН	
45	200 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	осн ₃	инсн3	СН	
50	201 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	oc ₂ H ₅	Н	CH ₃	N(CH ₃) ₂	СН	

Fortsetzung der Tabelle 1

5	Bsp.	Α	XR ¹	_R 2	_R 6	R6'	_ E	Fp
10	202 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	\triangleleft	СН	
	203 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	сн3	\neg	СН	
15	204 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	ochf ₂	ochf ₂	СН	
20	205 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	CH ₃	och ₃	осн3	СН	
25	206 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	CH ₃	СН3	сн3	СН	
3 <i>0</i>	207 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	OCH ₃	N	
	208 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	ос ₂ н ₅	Н	осн ₃	сн3	N	
35	209 (L)	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	scH ₂	N	
40	210 (L)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	CH ₃	СН3	N	
45	211 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	ос ₂ н ₅	н	ос ₂ н ₅	осн ₃	N	
	212 (L)	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	н	осн3	NHCH ₃	N	
50	213 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	oc ₂ H ₅	н	ос ₂ н ₅	NHCH3	N	

Fortsetzung d r Tabelle 1

Bsp Nr.		XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
214 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	NHC ₂ H ₅	N	
215 (L)	С ₂ н ₅ - сн	oc ₂ H ₅	н	oc ₂ # ₅	NHC ₂ H ₅	N	
216 (L)	С ₂ н ₅ - сн	oc ₂ H ₅	н	och ₃	N(CH ₃) ₂	N	
217 (L)	С ₂ Н ₅ -СН	ос ₂ н ₅	н	ос ₂ н ₅	N(CH ₃) ₂	N	
218 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	\triangleleft	N	
219 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	OCH ₂ CF ₃	N	
220 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	СН3	OCH ₂ CF ₃	N	
221 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	сн3	осн ₃	СН3	N	
222 (L)	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	CH ₃	осн ₃	осн3	N	
223 (L)	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	СН3	осн3	NHCH ₃	N	
22 4 (L)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
225 (L)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	CH ₃	СН	

EP 0 336 354 B1

5	Bsp.	Α	XR1	R ²	R ⁶	_R 6'	E	Fp
10	226 (D)	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	Н	осн3	осн3	СН	
	227 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	CH ₃	осн3	СН	
15	228 (D)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	Н	CH ₃	СН3	СН	
20	229 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
25	230 (D)	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	Н	OCHF ₂	ochf ₂	СН	182-184
	231 (D)	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	н	OCHF ₂	осн3	СН	
30	232 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	осн3	OCH ₂ CF ₃	СН	
35	233 (D)	С ₂ н ₅ -Сн	ос ₂ н ₅	Н	oc ₂ H ₅	och ₂ cF ₃	СН	
40	234 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	OC ₂ H ₅	СН	•
	235 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	scн ₃	CH ₃	СН	
45	236 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	осн3	NНСН3	СН	
50	237 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	СН3	N(CH ₃) ₂	СН	

EP 0 336 354 B1

5	Bsp. Nr.	A	XR1	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
10	238 (D)	С ₂ Н ₅ -СН	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	\prec	СН	
	239 (D)	с ₂ н ₅ -сн	oc ₂ H ₅	н	СН3	$\overline{}$	СН	
15	240 (D)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	OCHF ₂	СН	
20	241 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	СН	
25	242 (D)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	СН3	CH ₃	CH ₃	СН	
	243 (D)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	H	осн ₃	OCH ₃	N	
30	244 (D)	с2н5-сн	ос ₂ н ₅	Н	осн ₃	CH ₃	N	
35	245 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	scH ₂	N	
40	246 (D)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	Н	CH ₃	СН3	N	
	247 (D)	с ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	осн ₃	N	
45	248 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	осн ₃	инсн3	N	
50	249 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	ос ₂ н ₅	инсн3	N	

Fortsetzung d r Tabelle 1

5	Bsp.	A	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E Fp	
10	250 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	осн3	NHC ₂ H ₅	N	
	251 (D)	С ₂ н ₅ -Сн	ос ₂ н ₅	н	ос ₂ н ₅	NHC ₂ H ₅	N	
15	252 (D)	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	н	осн ₃	N(CH ₃) ₂	N	
20	253 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	N(CH ₃) ₂	N	
25	254 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	\triangleleft	N	
	255 (D)	С2Н5-СН	oc ₂ H ₅	н	осн3	OCH ₂ CF ₃	N	
30	256 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	N	
35	257 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	СН3	осн ₃	CH ₃	N	
40	258 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	СН3	осн ₃	осн3	N	
	259 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	СН3	осн3	NНСН ₃	N	
45	260 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	Н	осн3	осн3	СН	
50	261 (D)	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	СН3	СН	

Fortsetzung d r Tabell 1

Bsp	
-----	--

5	Nr.		XR ¹	R ²	R6	_R 6'	E	Fp
10		n-С3H7-СН	ос ₂ н ₅	н	СН3	Сн3	СН	
	263	n-С3H7-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	СН3	СН	
15	264	n-С ₃ Н ₇ -СН	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	осн3	СН	76-78
20	265	п-С3Н7-СН	ос ₂ н ₅	сн3	осн3	осн3	СН	
	266	n-С3H7-СН	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	Cl	СН	
25	267	n-С ₃ Н ₇ -СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	NHCH ₃	СН	
30	268	n-С ₃ Н ₇ -СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
	269	n-С ₃ Н ₇ -СН	oc ₂ H ₅	Н	осн ₃	SCH ₃	СН	
35	270	n-C3H7-CH	ос ₂ н ₅	Н	OCHF ₂	OCH ₃	СН	
40	271	n-C ₃ H ₇ -CH	ос ₂ н ₅	Н	осн3	CH ₃	N	
	272	n-С3H7-СН	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	N HCH ₃	N	
45	273	n-С3H7-СН	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	N(CH ₃) ₂	N	

50

Fortsetzung der Tabelle 1

-	

	Dop.				•-			
5	Nr.	Α	XR1	R ²	R6	_R 6'	E	Fp
	274	сн ₃ сн-сн	ос ₂ н ₅	н	сн3	СН3	СН	
10	275	CH ₃ CH-CH	oc ₂ H ₅	н	осн3	сн3	СН	
15	276	CH ₃ CH-CH	oc ₂ H ₅	н	осн3	осн3	СН	98-100
20	277	сн ₃ сн-сн	oc ₂ H ₅	CH ₃	осн3	OCH ₃	СН	
25	278	CH ₃ CH-CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
20	279	CH ₃ CH-CH	ос ₂ н ₅	Н	och ₃	NHCH ₃	СН	
30	280	CH ₃ CH-CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
35	281	сн ₃ сн-сн	oc ₂ H ₅	н	осн ₃	sch3	СН	
40	282	CH ₃ CH-CH	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	ОСН3	СН	
	283	CH ₃ CH-CH	oc ₂ H ₅	Н	осн3	СН3	N	
45	284	CH ₃ CH-CH	oc ₂ H ₅	н	ос ₂ н ₅	NHCH3	N	
50	285	CH ₃ CH-CH	oc ₂ H ₅	н	och ₃	N(CH ₃) ₂	N	

EP 0 336 354 B1

	Bsp.							
5	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	R6'	E	Fp
	286	СН	осн3	н	сн3	сн3	СН	
10	287	Сн	осн3	н	OCH ₃	сн3	СН	
15	288	СН	осн3	н	осн3	оснз	СН	
	289	Сн	och3	снз	OCH ₃	OCH ₃	СН	
20	290	Сн	OCH ₃	н	осн3	Cl	СН	
25	291	Сн	осн3	Н	осн3	и нсн ₃	СН	
30	292	Сн	осн3	Н	осн3	Br	СН	
30	293	Сн	осн3	н	осн3	scH ₃	СН	
35	294	Сн	осн3	н	ochf ₂	осн3	СН	
40	295	СН	осн3	н	осн3	Сн3	N	
70	296	Сн	осн3	н	oc ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
45	297	СН	осн3	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

Fortsetzung der Tabelle 1

	Bsp. Nr. A	XR ¹	R ²	 R6	_R 6'	E	Fp
5	C ₂ H ₅ 298 CH-CI						
10	С ₂ H ₅ 299 СН-СІ СН ₃	н ос ₂ н ₅	н	осн ₃	СНЗ	СН	
15	C ₂ H ₅ CH-CH	н ос ₂ н ₅	н	осн3	осн ₃	СН	Harz
20	301 CH-CI	н ос ₂ н ₅	сн3	осн3	оснз	СН	
25	C ₂ H ₅ 302 CH-CH-CH-CH-CH-CH-CH-CH-CH-CH-CH-CH-CH-C	н ос2н5	н	осн ₃	Cl	СН	
25	C ₂ H ₅ CH-C						
30	C ₂ H ₅ 304 CH-C						
35	C ₂ H ₅ 305 CH-C	н ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	scH ₃	СН	
40	C ₂ H ₅ 306 CH-C						
	C ₂ H ₅ CH-C					N	
45	308 CH-C	н ос ₂ н ₅	н	oc ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
50	C ₂ H ₅ CH ₃ CH-C	н ос ₂ н ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N .	

Fortsetzung der Tabelle 1

Bsp	
-----	--

5	Nr.	Α	XR1	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
3	310	CH ₃						
10	311	CH ₃ CHCH ₂ CH CH ₃	ос ₂ н ₅	н	осн3	СНЗ	СН	
15	312	CH ₃ CHCH ₂ CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
20	313	CH ₃ CHCH ₂ CH	oc ₂ H ₅	сн3	осн3	осн ₃	СН	
0.5	314	CH ₃ CHCH ₂ CH						
25	315	CH ₃ CHCH ₂ CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	N HCH ₃	СН	
30	316	CH ₃ CHCH ₂ CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
35	317	CH ₃ CHCH ₂ CH	oc ₂ H ₅	н	осн3	SCH ₃	CH ·	
40	318	CHCH ₂ CH	oc ₂ H ₅	н	OCHF ₂	осн3	CH	
	319	CH ₃ CHCH ₂ CH	oc ₂ H ₅	Ħ.	осн3	СН3	N	
45	320	CH ₃ CHCH ₂ CH	ос ₂ н ₅	н	ос ₂ н ₅	NHCH ₃	N	
50	321	CH ₃ CHCH ₂ CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

EP 0 336 354 B1

Fortsetzung der Tabelle 1

5	Bsp.
	Nr.

5	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	R6'	E	Fp
10	322	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	СН3	СН3	СН	
	323	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	CH ₃	СН	
15	324	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	Н	оснз	осн3	СН	
20	325	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	сн3	осн3	оснз	СН	
	326	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	Cl	СН	
25	327	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	NHCH ₃	СН	
30	328	CH ₂ =CH-CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
	329	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	SCH ₃	СН	
35	330	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	OCH ₃	СН	-
40	331	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	СН3	N	
	332	сн ₂ =сн-сн	ос ₂ н ₅	н	oc ₂ H ₅	NHCH3	N	
45	333	сн2=сн-сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

Fortsetzung der Tabelle 1

Bsp	

bsp.		_					
Nr.	<u> </u>	XR ¹	R ²	R6	R6'	<u>E</u>	Fp
334	н ₂ с=çн ç-сн ₂ н	oc ₂ H ₅	н	СН3	СН3	CH	
335	н ₂ с=сн с-сн ₂ н	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	СH ₃	СН	
336	ү-сн ₂				осн3		128-129
337	н ₂ с=сн	ос ₂ н ₅	СН3	осн ₃	осн3	CH	
338	н ₂ с=сн с-сн ₂ н	ос ₂ н ₅	Н	осн3	Cl	CH	
339	н ₂ с=сн с-сн ₂ н	oc ₂ H ₅	н	осн3	NHCH ₃	СН	
340	н ₂ с=сн с-сн ₂ н	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
341	н ₂ с=сн с-сн ₂ н	ос ₂ н ₅	н	осн3	sch ₃	СН	
342	н ₂ с=сн с-сн ₂ н	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	осн ₃	CH	
343	н ₂ с=сн	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	сн3	N	
344	н ₂ с=сн С-Сн ₂ н	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	NHCH 3	N	

EP 0 336 354 B1

Forts tzung der Tabelle 1

В	s	Ø	

5	Nr.	Α	XR1	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
	345	н ₂ с=сн с-сн ₂ н	oc ₂ H ₅	н	осн ₃	N(CH ₃) ₂	N	
10	346	ClCH ₂ -CH	ос ₂ н ₅	Н	СН3	СНЗ	СН	
15	347	С1СН2-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	СНЗ	СН	
	348	с1сн2-сн	ос ₂ н ₅	Н	осн3	OCH ₃	СН	68-70
20	349	С1СН2-СН	ос ₂ н ₅	СНЗ	оснз	осн3	СН	
25	350	CF3-CH	ос ₂ н ₅	Н	осн3	Cl	СН	
20	351	CF3-CH	ос ₂ н ₅	Н	осн3	NHCH ₃	CH	
30	352	CF3-CH	ос ₂ н ₅	Н	осн3	Br	СН	
	353	CF3-CH	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	SCH ₃	СН	
35	354	CF3CF2-CH	oc ₂ H ₅	Н	OCHF ₂	OCH ₃	СН	
40	355	CF3CF2-CH	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	CH ₃	N	
	356	CF3CF2-CH	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	NHCH ₃	N	
45	357	CF3CF2-CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

EP 0 336 354 B1

Fortsetzung d r Tab lle 1

Bsp.							
Nr.	Α	XR ¹	R ²	R6	R6'.	E	Fp
358	сн ₃ scн ₂ -сн	oc ₂ H ₅	н	CH ₃	СН3	СН	
359	сн ₃ scн ₂ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	СН3	СН	
360	CH ₃ SCH ₂ -CH .	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
361	сн ₃ осн ₂ - сн	ос ₂ н ₅	сн3	осн3	оснз	СН	
362	сн ₃ осн ₂ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
363	снзосн2-сн	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	М НСН ₃	СН	
364	сн ₃ ѕсн ₂ сн ₂ - сн	ос2н5	н	осн3	Br	СН	
365	сн ₃ ѕсн ₂ сн ₂ -сн	ос2н5	Н	осн3	SCH ₃	СН	
366	сн ₃ scн ₂ сн ₂ -сн	OC ₂ H ₅	н	ochf ₂	осн3	СН	
367	сн ₃ осн ₂ сн ₂ -сн	oc ₂ H ₅	н	осн3	CH ₃	N	
368	сн ₃ осн ₂ сн ₂ -сн	ос2Н5	н	oc ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
369	C1CH2CH2CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

Forts tzung d r Tabelle 1

В	8	a	

5	Nr.	A	XR ¹	D 2	R ⁶	R6'	E	Fp
		С6Н5-СН			-	сн3	СН	
10	371	С6Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	СНЗ	СН	
15	372	С ₆ Н ₅ -СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
	373	C6H5-CH	oc ₂ H ₅	сн3	осн3	осн3	СН	
20	374	С6Н5-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
25	375	CH CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	NHCH ₃	CH	
30	376	n			осн3		СН	
50	377	11	ос2н5	Н	осн3	scH ₃	СН	
35	378	C1 CH OCH ₃	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	осн3	СН	
40	379	€ CH	осн3	н	осн3	CH ₃	N	
45	380 (C1 - CH	och ₃	н	ос ₂ н ₅	NHCH3	N	
	381	11	осн3	Н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

EP 0 336 354 B1

Forts tzung der Tabelle 1

5	Bsp. Nr.	A	XR ¹	R2	_R 6	R6'	E	Fp
		с ₆ н ₅ -сн ₂ -сн				СН3	СН	
10	383	С6Н5-СН2-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	СН3	СН	
15	384	С6Н5-СН2-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн ₃	СН	144-145
	385	С6Н5-СН2-СН	ос ₂ н ₅	сн3	осн3	осн3	СН	
20	386	с ₆ н ₅ -сн ₂ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
25	387	С6Н5-СН2-СН	ос ₂ н ₅	н	осн3	NHCH3	СН	
	388	С6Н5-СН2-СН	oc ₂ H ₅	н	осн3	Br	СН	
30	389	с ₆ н ₅ -сн ₂ -сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	SCH ₃	СН	
35	390	с645-с42-сн	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	осн3	СН	
40	391	с645-с42-сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	СН3	N	
₩.	392	с ₆ н ₅ -сн ₂ -сн	ос ₂ н ₅	н	ос ₂ н ₅	NHCH ₃	N	
45	393	С6Н5-СН2-СН	OC ₂ H ₅	Н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

Fortsetzung d r Tabell 1

	Bsp.			•				
5	Nr.	Α	XR1	R ²	R6	R6'	E	Fp
10	370	С1 Ст. сн ₂ -сн	ос ₂ н ₅	Н	сн3	СН3	СН	
	371	11	ос ₂ н ₅	н	осн3	·CH3	СН	
15	372	n	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
20	373	F-CH ₂ -CH	ос ₂ н ₅	сн3	осн ₃	осн3	СН	
	374	11	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	Cl	СН	
25	375	n	ос ₂ н ₅	н	осн3	инсн3	СН	
30	376	NO ₂ CH ₂ -CH	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
	377	11	ос ₂ н ₅	н	осн3	SCH ₃	СН	
35	378	H	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	осн3	СН	
40	379	СООСН ₃ СН ₂ - СН	осн3	н	осн3	СН3	N	
	380	11	осн3	Н	ос ₂ н ₅	NHCH ₃	N	
45	381	n	осн3	н	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	N	

50

EP 0 336 354 B1

Fortsetzung d r Tabelle 1

5	Bsp.										
5	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	R6'	_ E	Fp			
10	406	CH ₂ =C	осн3	н	сн3	сн3	СН				
70	407	CH ₂ =C	och ₃	н	осн ₃	CH3	СН				
15	408	сн ₂ =с	осн3	н	осн3	осн3	СН				
20	409	CH ₂ =C	осн3	сн3	осн3	OCH ₃	СН				
	410	сн ₂ =с	осн3	н	осн3	Cl	СН				
25	411	сн ₂ =с	OCH ₃	н	och ₃	NHCH ₃	СН				
30	412	сн ₂ =с	осн3	н	OCH ₃	Br	СН				
	413	CH ₂ =C	осн3	н	осн3	SCH3	СН				
35	414	CH2=C	осн3	н	ochf ₂	осн3	СН				
40	415	CH ₂ =C	осн3	н	och ₃	СН3	N				
	416	CH ₂ =C	OCH ₃	н	OC2H5	NHCH ₃	N				
45	417	CH ₂ =C	осн3	н	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	N				

50

EP 0 336 354 B1

Forts tzung d r Tabell 1

5	Bsp.					_		
5	Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	_R 6'	E	Fp
	418	CH ₃ CH=C	ос ₂ н ₅	н	сн3	сн3	СН	
10	419	сн ₃ сн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	СН3	СН	
15	420	снзсн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	122-123
	421	снзсн=с	oc ₂ H ₅	СН3	осн3	осн3	СН	
20	422	снзсн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
25	423	снзсн=с	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	NHCH ₃	СН	
30	424	снзсн=с	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	Br	СН	
30	425	сн3сн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	scH ₃	СН	
35	426	сн ₃ сн=с	oc ₂ H ₅	Н	ochf ₂	осн3	СН	
40	427	снзсн=с	ос ₂ н ₅	Н	осн3	СН3	N	,
₩.	428	сн3сн=с	ос ₂ н ₅	н	oc ₂ H ₅	N HCH ₃	N	
45	429	снзсн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

EP 0 336 354 B1

Fortsetzung d r Tabelle 1

5	Bsp. Nr.	A	XR1	R ²	R ⁶	_R 6'	E	Fp
3	430	C ₂ H ₅ CH=C	ос ₂ н ₅	н	СН3	СН3	СН	
10	431	с ₂ н ₅ сн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	сн3	СН	
	432	с ₂ н ₅ сн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
15	433	C ₂ H ₅ CH=C	ос ₂ н ₅	сн3	осн ₃	осн ₃	СН	
20	434	C ₂ H ₅ CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
	435	с2н5сн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	NHCH ₃	СН	
25	436	C ₂ H ₅ CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
30	437	C ₂ H ₅ CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	scH ₃	СН	
	438	C ₂ H ₅ CH=C	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	осн3	СН	
35	439	C ₂ H ₅ CH=C	oc ₂ H ₅	н	осн3	сн3	N	
	440	C2H5CH=C	oc ₂ H ₅	н	oc ₂ H ₅	N HCH ₃	N	
40	441	C ₂ H ₅ CH=C	oc ₂ H ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	
45	442	сн ₃ снсн=	с ос ₂ н	5 Н	CH ₃	СН3	СН	

50

Forts tzung d r Tab lle 1

5	Bsp.							
3	Nr.	A	XR1	R ²	R ⁶	R6'	E	Fp
10	443	CH3						
15	444	СНЗ	oc ₂ H ₅	н	осн3	оснз	СН	Harz
13	445	CH ₃	oc ₂ H ₅	СН3	осн3	осн3	СН	
20	446	CH ₃ CHCH=C	oc ₂ H ₅	Н	осн3	Cl	СН	
25	447	CH ₃ CHCH=C	ос ₂ н ₅	Н	осн ₃	NHCH ₃	CH	
30	448	CH ₃						
35	449	CH ₃ CHCH=C	oc ₂ H ₅	Н	осн3	SCH3	СН	·
40	450	CH ₃	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	och ₃	СН	
	451	сн ₃ снсн=с	ос ₂ н ₅	н	осн3	CH ₃	N	
45	452	CH ₃ CHCH=C	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	NHCH3	N	
50	453	CH ₃ CHCH=C	ос ₂ н ₅	Н	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	N	

Fortsetzung der Tabelle 1

	вър.							
5	Nr.	A	XR1	R ²	R6	R6'	E	Fp
	454	CH ₃ C=C	ос ₂ н ₅	н	CH ₃	сн3	СН	
10	455	CH ₃ C=C	ос ₂ н ₅	Н	осн3	сн3	СН	
15	4 56	СH ₃ С=С	oc ₂ H ₅	н	осн3	осн3	СН	
20	4 57	CH ₃ C=C	oc ₂ H ₅	сн3	осн3	осн3	СН	
25	458	CH ₃ C=C	oc ₂ H ₅	н	осн3	Cl	CH	
30	459	CH ₃ C=C	oc ₂ H ₅	н	осн3	инсн3	СН	
	460	CH ₃ C=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
35	461	CH ₃ C=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	scH ₃	СН	
40	462	CH ₃ C=C	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	осн3	СН	
45	463	CH ₃ C=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	сн3	N	
50	464	CH ₃ C=C						

Forts tzung der Tabell 1

5	Bsp. Nr.	A	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
10	465	CH ₃ C=C					N	
	466	ĭ					СН	
15	467	C1 CH3C=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	CH ₃	СН	
20	468	С1 Сн3С=С	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
25	469	Br CH3-C=C	ос ₂ н ₅	СНЗ	осн3	осн3	СН	
	4 70	Br CH3-C=C	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	cı	СН	
30	471	Br CH ₃ -C=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	инсн3	СН	
35	472	CF3-CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	Br	СН	
40	473	CCl3-CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	scH ₃	СН	
	474	CCl3-CH=C	ос ₂ н ₅	н	OCHF ₂	осн ₃	СН	
45	475	CCl3-CH=C	oc ₂ H ₅	H	осн3	СН3	N	
50	476	CF ₃ C=C	ос ₂ н ₅	Н	ос ₂ н ₅	N HCH ₃	N	

Fortsetzung d r Tabelle 1

Bsp.	Α	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
477	CF ₃ C=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	
478	C6H5-CH=C	oc ₂ H ₅	н	СН3	СН3	СН	
4 79	C6H5-CH=C	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	CH ₃	СН	
480	C6H5-CH=C	oc ₂ H ₅	н	осн3	OCH ₃	СН	
481	C ₆ H ₅ -CH=C	ос ₂ н ₅	СНЗ	осн3	OCH ₃	СН	
482	C ₆ H ₅ -CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	Cl	СН	
483	C ₆ H ₅ -CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	NHCH ₃	СН	
484	C6H5-CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн ₃	Br	СН	
485	C6H5-CH=C	oc ₂ H ₅	н	осн3	SCH ₃	СН	
486	C6H5-CH=C	ос ₂ н ₅	н	ochf ₂	осн3	СН	·
487	C6H5-CH=C	ос ₂ н ₅	н	осн3	CH ₃	N	
488	C6H5-CH=C	oc ₂ H ₅	н	ос2н5	NHCH ₃	N	
489	C6H5-CH=C	ос ₂ н ₅	н	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	N	

50

EP 0 336 354 B1

Forts tzung der Tabelle 1

5	Bsp.				-	. •		
	Nr.	A	XR ¹	R ²	R ⁶	R6'	E	Fp
10	490	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	Н	СН3	сн3	СН .	
	491	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	осн3	сн3	СН	
15	492	СН3-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн ₃	осн3	СН	
20	493	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	СН3	осн3	осн3	СН	
	494	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	осн3	Cl	СН	
25	495	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	осн ₃	инсн3	СН	
30	496	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	осн3	Br	СН	
	497	СН3-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн3	scH ₃	СН	
35	498	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	OCHF ₂	осн3	СН	
40	499	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	осн3	СН3	N	
	500	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	ос ₂ н ₅	инсн3	N	
45	501	сн3-сн	N(CH ₃) ₂	н	осн3	N(CH ₃) ₂	N	

50

EP 0 336 354 B1

Forts tzung der Tabelle 1

5	Bsp. Nr.	A	XR ¹	R ²	R6	R6'	E	Fp
	502	с2н5-сн	N(CH ₃) ₂	СН3	осн ₃	осн3	СН	
10	503	С2Н5-СН	N(CH ₃) ₂	н	OCH ₃	OCH ₃	СН	184-186
15	504	С2Н5-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн3	Cl	СН	
	505	С2Н5-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн3	СН3	N	
20	506	С3H7-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн ₃	осн3	СН	
25	507	С3H7-СН	N(CH ₃) ₂	Н	осн ₃	СН3	N	
30	508	С3Н7-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн ₃	Cl	СН	
30	509	С3Н7-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн3	осн3	СН	
35	510	С3Н7-СН	N(CH ₃) ₂	н	осн3	CH ₃	N	

EP 0 336 354 B1

Forts tzung d r Tab lle 1

5	Bsp.	Α	XR ¹	R ²	_R 6	_R 6'	E	Fp
	511	CH3CH=C	N(CH ₃) ₂	сн3	осн ₃	осн3	СН	
10	512	снзсн=с	N(CH ₃) ₂	н	осн ₃	осн ₃	СН	
15	513	снзсн=с	N(CH ₃) ₂	н	осн3	Cl	СН	
	514	снзсн2сн=с	N(CH ₃) ₂	н	осн3	СН3	N	
20	515	CH=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	осн3	СН	142
25	516	•	N(CH ₃) ₂	н	осн3	сн3	N	
	517		N(CH ₃) ₂	н	осн3	Cl	СН	
30	518	11	N(CH ₃) ₂	н	осн3	осн3	СН	
35	519	n .	N(CH ₃)OCH ₃	н	осн3	сн3	N	

Forts tzung der Tab 11e 1

50

55

5	Bsp.							
	Nr.	Α	XR ¹	R ²	R6	R6'	E	Fp
10	520	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	СН3	осн3	осн3	СН	
15	521	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	осн3	СН	
20	522	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	Cl	СН	
20	523	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	СН3	N	
25	524	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	осн3	СН	
30	525	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	СН3	N	
35	526	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	Cl	СН	
40	527	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	осн3	СН	
45	528	CH ₃ C=C	N(CH ₃) ₂	н	осн3	СН3	N	

EP 0 336 354 B1

Fortsetzung der Tabelle 1

В	S	p	

5	Bsp. Nr.	Α	XR1	R ²	R6	R6'	E	Fp
10	529	С ₂ н ₅ -Сн	инсн3	СН3	осн3	OCH ₃	СН	
10	530	С ₂ н ₅ -Сн	sc ₂ H ₅	н	осн3	осн3	СН	
15	531	(CH ₃) ₂ C	ос ₂ н ₅	н	осн3	Cl	СН	
20	532	С2Н5 (СН3)С	ос ₂ н ₅	н	осн3	СН3	N	
20	533	С6Н5-СН2(СН3)С	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
25	536	сн ₂ =снсн ₂ (сн ₂)с	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
	537	CH2=CHCH2(CH2)C	OC ₂ H ₅	н	осн3	CH ₃	N	

	Bsp. Nr.	A	XR ¹	R ²	_R 6	R6'	E	Fp °C
20	538	с ₂ н ₅ -сн	осн3	н	осн3	осн3	СН	
05	539	С ₂ н ₅ -сн	осн3	сн3	OCH ₃	осн3	СН	
25	540	с ₂ н ₅ - сн	ос ₂ н ₅	н	осн3	осн3	СН	
30	541	С ₆ н ₅ -сн=с	oc ₂ H ₅	н	осн3	сн3	N	
	542	с2н5-сн	м(CH ₃) ₂	н	осн3	осн3	СН	
35	543	С6Н5-СН2СН	OCH ₃	Ĥ	осн3	сн3	N	
40	544	CH ₂ =CHCH ₂ -CH	OCH ₃	н	осн3	осн ₃	СН	
	545	сн≢с-сн₂сн	OCH ₃	н	осн3	Cl	СН	
45	546	CC13CH=C	осн ₃	н	оснз	OCH ₃	СН	

Tabelle 3 $(Y = 0, R^2 = H)$

$$R^{1}X - C - A - SO_{2} - NH - C - NH - R^{3}$$

Bsp. 10 XR1 R³ Fp °C Nr.

15				OCH ₃
	547	CH ₂	осн3	- CH ₂ (O)
				N
20				OCH ₃

CH₂ 548 OC2H5

549 CH3-CH OCH₃ 25

> C2H5-CH OC2H5 **5**50

C₃H₇-CH OCH₃ 551 30

> C₃H₇-CH OC₂H₅ 552

35 OCH₃ 553 CH₂ 40

осн3

OC₂H₅ 45 CH3-CH 555 OC2H5

CH₂

556 С₂Н₅-СН 0C2H5

50

554

Forts tzung von Tab 11e 3

	Bsp.		•		
5	Nr.	A	XR ¹	R ³	Fp °C
10	557	СН ₂	осн ₃	$-CH_2$ CH_3 CH_3 CH_3	
15	558	CH ₂	oc ₂ H ₅	n	
	559	CH ₃ -CH	ос ₂ н ₅	n	
20	560	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	n	
	561	С3Н7-СН	ос ₂ н ₅	H	
25	562	CH ₂	осн3		
				CH ₃	
30	563	CH ₃ -CH	осн3	n	
	564	сн ₃ -сн	ос ₂ н ₅	Ħ	
35	565	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	n	
	566	С3Н7-СН	ос ₂ н ₅	H	
40	567	CH ₂	ос ₂ н ₅		
				 осн ₃	
45	568	СН3-СН	oc ₂ H ₅	n	
	569	С ₂ Н ₅ -СН	oc ₂ H ₅	н	
50	570	С3Н7-СН	ос2н5	Ħ	

Fortsetzung von Tab 11e 3

Bsp.	•
------	---

	psp.				
5	Nr.	A	XR ¹	R ³	Fp °C
10	571	СН ₂	ос ₂ н ₅	CH ₃	
15	572	СН3-СН	oc ₂ H ₅	11	
	573	с ₂ н ₅ -сн	oc ₂ H ₅	H.	
20	574	С3H7-СН	ос ₂ н ₅	n	
25	575	сн ₂	ос ₂ н ₅	OCH ₃	·
30	576	CH ₃ -CH	oc ₂ H ₅	n	
	577	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	n	
35	578	С ₃ н ₇ -Сн	oc ₂ H ₅	11	
40	579	CH ₂	ос ₂ н ₅	OH OH	
45	580	СН3-СН	ос ₂ н ₅	п	
	581	С ₂ н ₅ -сн	ос ₂ н ₅	n	
50	582	С3Н7-СН	ос ₂ н ₅	12	

Forts tzung von Tabelle 3

	Bsp.				
5	Nr.	A	XR ¹	R ³	Fp °C
10	583	CH ₂	ос ₂ н ₅	CH ₃	
15	584	сн ₃ -сн	oc ₂ H ₅	n	
	585	С ₂ Н ₃ -СН	ос ₂ н ₅	n	
20	586	С3H7-СН	ос2н5	"	
25	587	CH ₂	ос ₂ н ₅	CH3	
30	588	Сн ₃ -Сн	ос ₂ н ₅	CH ₃	
	589	С ₂ н ₅ -Сн	oc ₂ H ₅	n	
35	590	С3H7-СН	ос2н5	" С́Н3	
40	591	сн ₂	ос ₂ н ₅	NO TO	
45				I осн ₃	
	592	сн3-сн	oc ₂ H ₅	Ħ	
50	593	С2Н5-СН	ос ₂ н ₅	11	•
50	594	С3Н7-СН	oc ₂ H ₅	11	

55 Bi logische B ispiele

Die Schädigung der Unkrautpflanzen bzw. die Kulturpflanzenverträglichkeit wurde gemäß einem Schlüssel bonitiert, in dem die Wirksamkeit durch Wertzahlen von 0 bis 5 ausgedrückt ist. Dabei bedeutet :

- 0 = ohne Wirkung
- 1 = 0 bis 20 % Wirkung bzw. Schaden
- 2 = 20 bis 40 % Wirkung bzw. Schaden
- 3 = 40 bis 60 % Wirkung bzw. Schaden
- 4 = 60 bis 80 % Wirkung bzw. Schaden
- 5 = 80 bis 100 % Wirkung bzw. Schaden

1. Unkrautwirkung im Vorauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen wurden in Plastiktöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern oder Emulsionskonzentraten formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden dann als wäßrige Suspensionen bzw. Emulsionen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert.

Nach der Behandlung wurden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. der Auflaufschäden erfolgte nach dem Auflaufen der Versuchspflanzen nach einer Versuchszeit von 3 bis 4 Wochen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen. Wie die Boniturwerte in Tabelle I zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen eine gute herbizide Vorauflaufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf.

2. Unkrautwirkung im Nachauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkräutern wurden in Plastiktöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Drei Wochen nach der Aussaat wurden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt.

Die als Spritzpulver bzw. als Emulsionskonzentrate formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden in verschiedenen Dosierungen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 I/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht und nach ca. 3 bis 4 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen die Wirkung der Präparate optisch im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert.

Die erfindungsgemäßen Mittel weisen auch im Nachauflauf eine gute herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger Ungräser und Unkräuter auf (Tabelle II).

35 3. Kulturpflanzenverträglichkeit

In weiteren Versuchen im Gewächshaus wurden Samen einer größeren Anzahl von Kulturpflanzen und Unkräutern in sandigem Lehmboden ausgelegt und mit Erde abgedeckt.

Ein Teil der Töpfe wurde sofort wie unter 1. beschrieben behandelt, die übrigen im Gewächshaus aufgestellt, bis die Pflanzen zwei bis drei echte Blätter entwickelt hatten und dann mit den erfindungsgemäßen Substanzen in unterschiedlichen Dosierungen, wie unter 2. beschrieben besprüht.

Vier bis fünf Wochen nach der Applikation und Standzeit im Gewächshaus wurde mittels optischer Bonitur festgestellt, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen zweikeimblättrige Kulturen wie z.B. Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben und Kartoffeln im Vor- und Nachauflaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt ließen. Einige Substanzen schonten darüber hinaus auch Gramineen-Kulturen wie z.B. Gerste, Weizen, Roggen, Sorghum-Hirsen, Mais oder Reis. Die Verbindungen der Formel I weisen somit eine hohe Selektivität bei Anwendung zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen auf.

50

15

Tabell I: Vorauflaufwirkung der rfindungsg mäß n
- V rbindungen

5	

Produkt	Dosis	1	herbizid	e Wirkung	3
Nr.	kg a.i./ha	SIA	CRS	STM	LOM
1	0,6	5	5	5	5
2	0,6	5	5 .	5	5
3	0,6	5	5	2	5
4	0,6	5	5	5	5
6	0,6	5	5	5	5
16	0,6	5	3	5	4
28	0,6	5	5	5	5
32	0,6	5	5	5	5
40	0,6	5	5	5	5
46	0,6	5	5	5	4
49	0,6	5	2	5	5
64	0,6	5	5	4	2
77	0,6	5	5	4	3
82	0,6	5	5	5	5
136	0,6	5	5	5	5
154	0,6	5	4	5	5
157	0,6	5	5	4	4
230	0,6	4	5	5	2
264	0,6	5	5	5	3

Fortsetzung der Tabell I:

Produkt	Dosis	herbizide Wirkung				
Nr.	kg a.i./ha	SIA	CRS	STM	LOM	
276	0,6	5	4	3	5	
300	0,6	5	5	5	4	
336	0,6	5	5	4	ż	
384	0,6	4	5	4	5	
420	0,6	5	5	5	5	
444	0,6	5	3	5	4	
503	0,6	5	5	5	2	

Tabelle II: Nachauflaufwirkung

Produkt	Dosis	1	herbizid	e Wirkung	,
Nr.	kg a.i./ha	SIA	CRS	STM	LOM
1	0,6	5	5	5	5
2	0,6	5	5	5	5
3	0,6	5	5	4	5
4	0,6	5	5	5	5
6	0,6	4	5	5	5
16	0,6	5	5	5	5
28	0,6	5	5	5	5
32	0,6	5	5	5	5
40	0,6	5	5	5	5
46	0,6	5	5	5	5
49	0,6	5	5	5	5
65	0,6	5	5	5	5
77	0,6	5	5	5	5
82	0,6	5	5	5	5
136	0,6	5	5	5	5
154	0,6	5	5	5	4
157	0,6	5	5	5	5
230	0,6	4	5	5	5
264	0,6	5	5	5	5

55

Fortsetzung der Tabelle II:

Produkt	Dosis	1	herbizid	e Wirkun	3
Nr.	kg a.i./ha	SIA	CRS	STM	LOM
276	0,6	5	4	5	5
300	0,6	4	5	5	5
336	0,6	5	5	5	4
384	0,6	5	5	5	5
420	0,6	5	5	5	5
444	0,6	5	5	5	5
503	0,6	5	5	5	5

Abkürzungen:

SIA = Sinapis alba

CRS = Chrysanthemum segetum

STM = Stellaria media

LOM = Lolium multiflorum

Wuchshemmung an Getreide

30

25

In Schalenversuchen im Gewächshaus wurden junge Getreidepflanzen (Weizen, Gerste, Roggen) im 3-Blattstadium mit erfindungsgemäßen Verbindungen in verschiedenen Wirkstoffkonzentrationen (kg/ha) tropfnass gespritzt.

Nachdem die unbehandelten Kontrollpflanzen eine Wuchshöhe von etwa 55 cm erreicht hatten, wurde bei allen Pflanzen der Zuwachs gemessen und die Wuchshemmung in % des Zuwachses der Kontrollpflanzen berechnet. Es wurde außerdem die phytotoxische Wirkung der Verbindungen beobachtet, wobei 100 % den Stillstand des Wachstums und 0 % ein Wachstum entsprechend den unbehandelten Kontrollpflanzen bedeuten. Es zeigte sich, daß die Verbindungen sehr gute wachstumsregulierende Eigenschaften besitzen. Die Ergebnisse sind in der nachfolgenden Tabelle III zusammengestellt.

Tabelle III

	Verbindungen nach BspNr.	Anwendungskonz. kg/ha	Wuchshemmung (%)			Phytotox. Wirkung
45			Weizen	Gerste	Roggen	
	1	0,62 0,31	22 17	32 24	19 17	keine Schäden
50	16	0,62 0,31	23 17	37 22	24 16	keine Schäden
	154	0,62 0,31	21 16	34 21	24 17	keine Schäden
55	276	0,62 0,31	24 19	26 23	23 18	keine Schäden

Patentansprüche

Pat ntansprüche für f Igend V rtragsstaat n: AT, BE, CH, DE, FR, GB, IT, LI, NL, SE

1. Verbindungen der Formel I

0 X-R¹ Y R² (1),

worin

A = einen Rest der Formel $> C(R^4)_2$ oder $> C = C(R^5)_2$,

R¹ = H, (C₁-C₈)Alkyl, (C₂-C₈)Alkenyl, (C₂-C₈)Alkinyl, wobei diese aliphatischen Reste ein- oder mehrfach durch Halogen, oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₂-C₆)-Alkenyloxy, (C₂-C₆)Alkinyloxy, (C₁-C₆)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)Alkoxycarbonyl oder durch Phenyl Substituiert sein können; (C₃-C₃)Cycloalkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy oder (C₁-C₆)-Alkylthio substituiert sein kann; (C₅-C₆)Cycloalkenyl, Cyclopropylmethyl, Epoxypropyl, Furfuryl, Tetrahydrofurfuryl, Phenoxy(C₁-C₆)alkyl oder Phenyl, die beide im Phenyl-Ring durch Halogen, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy oder NO₂ substituiert sein können,

 R^2 = H, $(C_1-C_8)Alkyl$, $(C_2-C_8)Alkenyl$, $(C_2-C_8)Alkinyl$ oder $(C_1-C_4)Alkoxy$,

R³ = einen Rest der Formel

25

30

35

40

45

50

55

R5 =

20

5

10

15

R⁴ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, wobei die vorgenannten C-haltigen Reste ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₂-C₆)Alkenyloxy, (C₂-C₆)Alkinyloxy, (C₁-C₆)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl oder (C₁-C₆)Alkoxycarbonyl oder durch Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxycarbonyl oder NO₂ substituiert sein kann, substituiert sein können, ferner einer der beiden Reste R⁴ Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen,

(C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, NO₂ oder CF₃ substituiert sein kann,

unabhängig voneinander H, (C₁-C₆)Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₆)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, oder (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann oder einer der Reste R⁵ Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, NO₂, CF₃ oder (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann, oder beide Reste R⁵ gemeinsam einen Alkylenrest (CH₂)_n,

R⁶ = unabhängig voneinander H, Halogen, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy oder (C₁-C₆)Alkylthio, die ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkoxy oder (C₁-C₄)Alkylthio substituiert sein können; einen Rest N(R¹¹)₂, (C₃-C₅)Cycloalkyl, -OCHR⁷COOR¹¹, (C₃-C₅)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkinyl, (C₃-C₅)Alkenyloxy oder (C₃-C₅)-Alkinyloxy,

 $R^7 = H \text{ oder } (C_1-C_4)Alkyl,$

 $R^8 = (C_1-C_4)Alkyl, -CHF_2 \text{ oder } -CH_2CF_3,$

R⁹ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy oder Halogen,

 R^{10} = H, $(C_1-C_4)Alkyl$, $-CHF_2$ oder $-CH_2CF_3$,

R¹¹ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₄)Alkyl, (C₂-C₄)Alkenyl oder (C₃-C₄)Alkinyl,

E = CH oder N,

 $G = CH_2 \text{ oder } O$,

X = 0, S oder NR^{12} .

Y = O oder S.

 R^{12} = H, $(C_1-C_6)AlkyI$, $(C_2-C_6)AlkenyI$, $(C_2-C_6)AlkinyI$, $(C_1-C_6)Alkoxy$, oder einen Rest der Formel

(CH₂)_p Z

n = eine ganze Zahl von 3 bis 6.

p = eine ganze Zahl von 1 bis 3,

q = eine ganze Zahl von 0 bis 3 und

Z = O, S, CH₂, NH oder N(C₁-C₄-Alkyl) bedeuten, oder deren für die Landwirtschaft einsetzbaren Salze.

30

35

40

50

55

5

10

15

20

2. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

A einen Rest > $C(R^4)_2$ oder > $C = C(R^5)_2$

R¹ (C₁-C₄)Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- bis zweifach durch (C₁-C₄)-Alkoxy substituiert sein kann,

R² H, (C₁-C₄)Alkyl oder Allyl,

R³ einen Rest der Formel

₩₈₆

unabhängig voneinander H oder (C₁-C₆)Alkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- bis zweifach durch (C₁-C₄-)Alkoxy oder (C₁-C₄)-Alkylthio substituiert sein kann, oder ein Rest R⁴ (C₂-C₆)Alkenyl oder Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, NO₂ oder CF₃ substituiert sein kann, und der andere Rest R⁴ für Wasserstoff,

R⁵ unabhängig voneinander H oder (C₁-C₆)Alkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiert sein kann,

R⁶ unabhängig voneinander Halogen, (C₁-C₄)Alkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy, die beide halogeniert sein können,

E CH oder N,

X O, S oder NR¹²,

Y O oder S und

R¹² H, (C₁-C₄)Alkyl oder (C₂-C₄)Alkenyl bedeuten.

- Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß ein Rest R⁴ für (C₁-C₄)-Alkyl oder für Phenyl, das ein- bis dreifach durch Fluor, Chlor, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkyl oder Nitro substituiert ist, steht und der andere Rest R⁴ für Wasserstoff steht.
- 5 4. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß R¹ (C₁-C₄)-Alkyl und R² Wasserstoff bedeuten.
 - Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß R⁶ CH₃, OCH₃, OC₂H₅, CI oder OCF₂H bedeutet.
 - 6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I von Anspruch 1 oder deren Salze, dadurch gekennzeichnet, daß man
 - (a) eine Verbindung der Formel (II)

wobei A, X, Y, R^1 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, mit der Ausnahme, daß $R^1 \neq H$ und X $\neq NH$ sind, mit einer Verbindung der Formel (III)

30 umsetzt,

10

15

20

50

(b) eine Verbindung der Formel (IV)

40 mit einem (Thio)-Carbamat der Formel (V)

wobei R^{13} (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₄)Halogenalkyl oder Phenyl bedeutet, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, oder NO₂ substituiert sein kann, umsetzt,

(c) ein (Thio)-Carbamat der Formel (VI) mit einer Verbindung der Formel (III)

wobei R¹³ die oben angegebene Bedeutung hat, umsetzt oder (d) eine Carbonsäure der Formel (VII)

mit einem Alkylierungsreagens der Formel (VIII)

5

10

15

25

30

wobei X für eine nucleofuge Abgangsgruppe steht, umsetzt und die erhaltenen Verbindungen gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

- Herbizide oder pflanzenwachstumsregulierende Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine wirksame
 Menge einer Verbindung der Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 5, deren Stereoisomer oder deren Salz und inerte Hilfsstoffe enthalten.
 - 8. Verwendung der Verbindungen der Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 5, deren Stereoisomeren oder deren Salze als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.
 - 9. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die landwirtschaftlich oder industriell genutzten Böden eine wirksame Menge einer nach einem der Ansprüche 1 bis 5 definierten Verbindung der Formel I oder deren Stereoisomeren oder deren Salz appliziert.
 - 10. Verfahren zur Wachstumsregulation von Nutzpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die Anbaufläche eine wirksame Menge einer Verbindung der Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 5 oder deren Stereoisomer oder deren Salz appliziert.

Patentansprüche für folgenden Vertragsstaat: ES

1. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I

worin

A = einen Rest der Formel $> C(R^4)_2$ oder $> C = C(R^5)_2$,

R¹ = H, (C₁-C₈)Alkyl, (C₂-C₈)Alkenyl, (C₂-C₈)Alkinyl, wobei diese aliphatischen Reste ein- oder mehrfach durch Halogen, oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₂-C₆)-Alkenyloxy, (C₂-C₆)Alkinyloxy, (C₁-C₆)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)Alkoxycarbonyl oder durch Phenyl substituiert sein können; (C₃-C₈)Cycloalkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkoxy oder (C₁-C₄)-Alkylthio substituiert sein kann; (C₅-C₈)Cycloalkenyl, Cyclopropylmethyl, Epoxypropyl, Furfuryl, Tetrahydrofurfuryl, Phenoxy(C₁-C₆)alkyl oder Phenyl, die beide im Phenyl-Ring durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy oder NO₂ substituiert sein können,

 R^2 = H, (C_1-C_8) Alkyl, (C_2-C_8) Alkenyl, (C_2-C_8) Alkinyl oder (C_1-C_4) Alkoxy,

R³ = einen Rest der Formel

55

45

50

20 R⁴ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, (C₃-C₈)Cycloalkyl, wobei die vorgenannten C-haltigen Reste ein- oder mehrfach durch Halogen
oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₂-C₆)Alkenyloxy, (C₂-C₆)Alkinyloxy, (C₁C₆)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)Alkylsulfonyl oder (C₁-C₆)Alkoxycarbonyl oder
durch Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkoxycarbonyl oder NO₂ substituiert sein kann, substituiert sein
können, ferner einer der beiden Reste R⁴ Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen,
(C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, NO₂ oder CF₃ substituiert sein kann,

R⁵ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₆)Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen oder einoder zweifach durch (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₆)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkylsulfinyl, oder (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann oder einer der Reste R⁵ Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, NO₂, CF₃ oder (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann, oder beide Reste R⁵ gemeinsam einen Alkylenrest (CH₂)_n,

R⁶ = unabhängig voneinander H, Halogen, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy oder (C₁-C₆)Alkylthio, die ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkoxy oder (C₁-C₄)Alkylthio substituiert sein können; einen Rest N(R¹¹)₂, (C₃-C₅)Cycloalkyl, -OCHR⁷COOR¹¹, (C₃-C₅)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkinyl, (C₃-C₅)Alkenyloxy oder (C₃-C₅)-Alkinyloxy,

 $R^7 = H \text{ oder } (C_1 - C_4) Alkyl,$

 $R^8 = (C_1-C_4)Alkyl, -CHF_2 \text{ oder } -CH_2CF_3,$

R⁹ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy oder Halogen,

 $R^{10} = H_1 (C_1-C_4)Alkyl_1 - CHF_2 oder - CH_2CF_3$

R¹¹ = unabhängig voneinander H, (C₁-C₄)Alkyl, (C₂-C₄)Alkenyl oder (C₃-C₄)Alkinyl,

E = CH oder N,

30

35

40

45

50

G = CH₂ oder O,

X = 0, S oder NR^{12} ,

Y = O oder S,

 R^{12} = H, $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_1-C_6)Alkoxy$, oder einen Rest der Formel

55 (CH₂)_p Z

n = eine ganze Zahl von 3 bis 6,

p = eine ganze Zahl von 1 bis 3,

q = eine ganze Zahl von 0 bis 3 und

Z = O, S, CH₂, NH oder N(C₁-C₄-Alkyl) bedeuten, oder deren für die Landwirtschaft einsetzbaren Salze,

dadurch gekennzeichnet, daß man

(a) eine Verbindung der Formel (II)

wobei A, X, Y, R^1 die in Formel (I) angegebenen Bedeutung haben, mit der Ausnahme, daß $R^1 \neq H$ und $X \neq NH$ sind, mit einer Verbindung der Formel (III)

$$\begin{array}{c} H-N-R^2 \\ 13 \end{array} \tag{III}$$

umsetzt,

5

10

15

25

30

35

40

45

50

(b) eine Verbindung der Formel (IV)

mit einem (Thio)-Carbamat der Formel (V)

$$R^{13} = 0 - C - N - R^{2}$$

$$R^{13} = 0 - C - N - R^{2}$$

$$R^{13} = 0$$
(V)

wobei R¹³ (C₁-C₅)Alkyl, (C₁-C₄)Halogenalkyl oder Phenyl bedeutet, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, oder NO₂ substituiert sein kann, umsetzt,

(c) ein (Thio)-Carbamat der Formel (VI) mit einer Verbindung der Formel (III)

wobei R13 die oben angegebene Bedeutung hat, umsetzt oder

(d) eine Carbonsäure der Formel (VII)

5 OH Y (V11)

10

mit einem Alkylierungsreagens der Formel (VIII)

R1-X (VIII)

15

wobei X für eine nucleofuge Abgangsgruppe steht, umsetzt und die erhaltenen Verbindungen gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

2. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in Formel (I)

A einen Rest > $C(R^4)_2$ oder > $C = C(R^5)_2$

R¹ (C₁-C₄)Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- bis zweifach durch (C₁-C₄)- Alkoxy substituiert sein kann,

R² H, (C₁-C₄)Alkyl oder Allyl,

R³ einen Rest der Formel

25

20

R6 ,

30

- R⁴ unabhängig voneinander H oder (C₁-C₆)Alkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen oder ein- bis zweifach durch (C₁-C₄-)Alkoxy oder (C₁-C₄)-Alkylthio substituiert sein kann, oder ein Rest R⁴ (C₂-C₆)Alkenyl oder Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, NO₂ oder CF₃ substituiert sein kann, und der andere Rest R⁴ für Wasserstoff,
- R⁵ unabhängig voneinander H oder (C₁-C₆)Alkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiert sein kann,
- R⁶ unabhängig voneinander Halogen, (C₁-C₄)Alkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy, die beide halogeniert sein können,
- 40 E CH oder N,
 - X O, S oder NR¹²,
 - Y O oder S und
 - H, (C₁-C₄)Alkyl oder (C₂-C₄)Alkenyl bedeuten.
- 45 3. Verfahren nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß ein Rest R⁴ für (C₁-C₄)-Alkyl oder für Phenyl, das ein- bis dreifach durch Fluor, Chlor, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkyl oder Nitro substituiert ist, steht und der andere Rest R⁴ für Wasserstoff steht.
- Verfahren nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß R¹ (C₁-C₄)-Alkyl und R²
 Wasserstoff bedeuten.
 - Verfahren nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß R⁶ CH₃, OCH₃, OC₂H₅, CI oder OCF₂H bedeutet.
- 55 6. Verwendung der gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 definierten Verbindungen der Formel I, deren Stereoisomeren oder deren Salze als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.

- 7. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die landwirtschaftlich oder industriell genutzten Böden eine wirksame Menge einer gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 definierten Verbindung der Formel I oder deren Stereoisomeren oder deren Salz appliziert.
- 8. Verfahren zur Wachstumsregulation von Nutzpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die Anbaufläche eine wirksame Menge einer gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 definierten Verbindung von Formel I oder deren Stereoisomer oder deren Salz appliziert.

10 Claims

5

15

20

25

30

35

40

45

50

55

the R4

Claims for the following Contracting States: AT, BE, CH, DE, FR, GB, IT, LI, NL, SE.

1. A compound of the formula I

0 x-R1 A y R2 (1), 502-NH-C-N-R3

wherein A

denotes a radical of the formula $> C(R^4)_2$ or $> C = C(R^5)_2$,

 $\begin{array}{ll} C_4) \text{alkyl, } (C_1\text{-}C_4) \text{alkoxy or NO}_2, \\ \text{R}^2 & \text{denotes H, } (C_1\text{-}C_8) \text{alkyl, } (C_2\text{-}C_8) \text{alkenyl, } (C_2\text{-}C_8)\text{-alkynyl or } (C_1\text{-}C_4) \text{alkoxy,} \\ \end{array}$

R³ denotes a radical of the formula

radicals independently of one another denote H, (C_1-C_6) alkyl, (C_2-C_6) alkenyl, (C_2-C_6) alkynyl, (C_3-C_8) cycloalkyl, it being possible for the abovementioned radicals which contain C to be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted or disubstituted by (C_1-C_6) alkoxy, (C_2-C_6) alkenyloxy, (C_2-C_6) alkynyloxy, (C_1-C_6) alkylsulfinyl, (C_1-C_6) alkylsulfinyl or (C_1-C_6) alkoxycarbonyl, or by phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or NO_2 , it being furthermore possible for one of the two radicals R^4 to denote phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkoxy, NO_2 or CF_3 ,

the R5 radicals independently of one another denote H, or (C₁-C₆)alkyl, which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted or disubstituted by (C₁-C₆)alkoxy, (C_1-C_6) alkylthio, (C_1-C_6) alkylsulfinyl or (C_1-C_6) alkoxycarbonyl, or it being possible for one of the radicals R5 to denote phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, NO₂, CF₃ or (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, or 5 for the two radicals R⁵ together to denote an alkylene radical -(CH₂)_n-, the R6 radicals independently of one another denote H, halogen, or (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy or (C_1-C_6) -alkylthio which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted or disubstituted by (C₁-C₄)alkoxy or (C₁-C₄)alkylthio; a radical N(R¹¹)₂, (C₃-C₆)cycloalkyl, -OCHR⁷COOR¹¹, (C₃-C₅)alkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₃-C₅)alkenyloxy or 10 (C₃-C₅)alkynyloxy, R^7 denotes H or (C1-C4)alkyl, R8 denotes (C1-C4)alkyl, -CHF2 or -CH2CF3, the R9 radicals independently of one another denote H, (C1-C4)alkyl, (C1-C4)alkoxy or halogen, R^{10} denotes H, (C1-C4)alkyl, -CHF2 or -CH2CF3, 15 the R11 radicals independently of one another denote H, (C1-C4)alkyl, (C2-C4)alkenyl or (C2-C4)alkynyl, Е denotes CH or N, G denotes CH2 or O, 20 Х denotes O, S or NR12, denotes O or S, R12 denotes H, (C_1-C_6) alkyl, (C_2-C_6) alkenyl, (C_2-C_6) alkynyl, (C_1-C_6) alkoxy, or a radical of the formula 25 30 n denotes an integer from 3 to 6, denotes an integer from 1 to 3, р denotes an integer from 0 to 3 and q Z denotes O, S, CH₂, NH or N(C₁-C₄-alkyl), or the salts thereof which can be employed in 35 agriculture. A compound of the formula I as claimed in claim 1, wherein denotes a radical $> C(R^4)_2$ or $> C = C(R^5)_2$, 40 Α R¹ denotes (C₁-C₄)alkyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted to disubstituted by (C₁-C₄)alkoxy, R2 denotes H, (C₁-C₄)alkyl or allyl, R^3 denotes a radical of the formula 45 50 the R4 radicals independently of one another denote H, or (C1-C6)alkyl which can optionally be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted to disubstituted by (C₁-C₄)alkoxy or (C₁-C₄)alkylthio, or a radical R⁴ denotes (C₂-C₆)alkenyl or phenyl which 55 can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, No₂ or CF₃, and the other radical R⁴ denotes hydrogen, the R5 radicals independently of one another denote H, or (C1-C6)alkyl, which can optionally be

monosubstituted or polysubstituted by halogen,

the R⁶ radicals independently of one another denote halogen, (C₁-C₄)alkyl or (C₁-C₄)alkoxy, both of which can be halogenated,

E denotes CH or N,

X denotes O, S or NR¹²,

Y denotes O or S and

 R^{12} denotes H, (C_1-C_4) alkyl or (C_2-C_4) alkenyl.

- 3. A compound as claimed in claim 1 or 2, wherein one radical R⁴ is (C₁-C₄)alkyl or is phenyl which is monosubstituted to trisubstituted by fluorine, chlorine, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)-alkyl or nitro, and the other radical R⁴ is hydrogen.
- A compound as claimed in one of claims 1 to 3, wherein R¹ denotes (C₁-C₄)alkyl and R² denotes hydrogen.
- 15 S. A compound as claimed in one of claims 1 to 4, wherein R⁶ denotes CH₃, OCH₃, OC₂H₅, Cl or OCF₂H.
 - A process for the preparation of a compound of the formula I of claim 1 or a salt thereof, which comprises reacting
 - (a) a compound of the formula (II)

20

5

10

25

where A, X, Y, R^1 have the meaning indicated in claim 1, with the exception that R^1 is not H and X is not NH, with a compound of the formula (III)

30

35

(b) a compound of the formula (IV)

40

45

with a (thio)carbamate of the formula (V)

(V),

50

where R^{13} denotes (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl or phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C_1-C_4) alkyl or NO_2 ,

55

(c) a (thio)carbamate of the formula (VI) with a compound of the formula (III)

5 x-R1 (VI),

where R¹³ has the abovementioned meaning, or
 (d) a carboxylic acid of the formula (VII)

O OH (VII)

20 with an alkylating reagent of the formula (VIII)

R¹-X (VIII)

15

25

35

40

50

55

where X represents a nucleofugic leaving group, and, if appropriate, converting the resulting compound to a salt thereof.

- 7. A herbicidal or plant-growth-regulating agent, which contains an effective amount of a compound of the formula I as claimed in one of claims 1 to 5, a stereoisomer or a salt thereof and inert auxiliaries.
- 30 8. The use of a compound of the formula I as claimed in one of claims 1 to 5, a stereoisomer or a salt thereof as a herbicide or plant growth regulator.
 - 9. A method of controlling noxious plants, which comprises applying an effective amount of a compound of the formula I defined as claimed in one of claims 1 to 5 or a stereoisomer or a salt thereof to these noxious plants or the soils which are used in agriculture or industry.
 - 10. A method of regulating the growth of crop plants, which comprises applying an effective amount of a compound of the formula I as claimed in one of claims 1 to 5 or a stereoisomer or a salt thereof to these crop plants or the cropped area.

Claims for the following Contracting State: ES

1. A process for the preparation of a compound of the formula I

wherein A R¹

denotes a radical of the formula $> C(R^4)2$ or $> C = C(R^5)_2$, denotes H, (C_1-C_8) alkyl, (C_2-C_8) alkenyl, (C_2-C_8) alkyl

denotes H, (C_1-C_8) alkyl, (C_2-C_8) alkenyl, (C_2-C_8) alkynyl, it being possible for these aliphatic radicals to be monosubstituted or polysubstituted by halogen, or to be monosubstituted or disubstituted by (C_1-C_6) alkoxy, (C_2-C_6) alkenyloxy, (C_2-C_6) alkynyloxy, (C_1-C_6) alkylthio, (C_1-C_6) alkylsulfinyl, (C_1-C_6) alkylsulfinyl, (C_1-C_6) alkoxycarbonyl or by phenyl; (C_3-C_8) cycloalkyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, or

monosubstituted or disubstituted by (C_1-C_4) alkoxy or (C_1-C_4) alkylthio; (C_5-C_8) -cycloalkenyl, cyclopropylmethyl, epoxypropyl, furfuryl, tetrahydrofurfuryl, or phenoxy(C_1-C_6)alkyl or phenyl, both of which can be substituted in the phenyl ring by halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkoxy or NO_2 ,

R² denotes H, (C₁-C₈)alkyl, (C₂-C₈)alkenyl, (C₂-C₈)alkynyl or (C₁-C₄)alkoxy,

R³ denotes a radical of the formula

the R⁴ radicals independently of one another denote H, (C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, (C₃-C₈)cycloalkyl, it being possible for the abovementioned radicals which contain C to be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted or

disubstituted by (C_1-C_6) alkoxy, (C_2-C_6) alkenyloxy, (C_2-C_6) alkynyloxy, (C_1-C_6) alkylsulfinyl, (C_1-C_6) alkylsulfinyl, or by phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkoxycarbonyl or (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkylt

two radicals R⁴ to denote phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, NO₂ or CF₃,

the R⁵ radicals independently of one another denote H, or (C₁-C₆)alkyl, which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted or disubstituted by (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl or (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, or it being possible for one of the radicals R⁵ to denote phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, NO₂ CF₃ or (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, or

for the two radicals R⁵ together to denote an alkylene radical -(CH₂)_n-,

 (C_3-C_6) cycloalkyl, $-OCHR^7COOR^{11}$, (C_3-C_5) alkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_3-C_5) alkenyloxy or (C_3-C_5) alkynyloxy,

 R^7 denotes H or (C_1-C_4) alkyl,

R8 denotes (C₁-C₄)alkyl, -CHF₂ or -CH₂CF₃,

the R⁹ radicals independently of one another denote H, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy or halogen,

R¹⁰ denotes H, (C₁-C₄)alkyl, -CHF₂ or -CH₂CF₃,

the R¹¹ radicals independently of one another denote H, (C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl or (C₃-C₄)-alkynyl,

E denotes CH or N,

G denotes CH₂ or O,

X denotes O, S or NR¹²,

Y denotes O or S,

 R^{12} denotes H, (C_1-C_6) alkyl, (C_2-C_6) alkenyl, (C_2-C_6) alkynyl, (C_1-C_6) alkoxy, or a radical of the formula

55

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

- n denotes an integer from 3 to 6, p denotes an integer from 1 to 3,
- q denotes an integer from 0 to 3 and Z denotes O, S, CH₂, NH or N(C₁-C₄
 - denotes O, S, CH₂, NH or N(C₁-C₄-alkyl), or the salts thereof which can be employed in agriculture, which comprises reacting
 - (a) a compound of the formula (II)

where A, X, Y, R^1 have the meaning indicated in claim 1, with the exception that R^1 is not H and X is not NH, with a compound of the formula (III)

$$H-N-R^2$$

$$\frac{1}{2}$$
(III)

(b) a compound of the formula (IV)

with a (thio)carbamate of the formula (V)

$$R^{13} = 0 - C - N - R^2$$
 R^{3}
 R^{3}

where R^{13} denotes (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl or phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C_1-C_4) alkyl or NO_2 , (c) a (thio)carbamate of the formula (VI) with a compound of the formula (III)

where R¹³ has the abovementioned meaning, or (d) a carboxylic acid of the formula (VII)

10

5

with an alkylating reagent of the formula (VIII)

R1-X (VIII)

15

20

where X represents a nucleofugic leaving group, and, if appropriate, converting the resulting compound to a salt thereof.

2. The process as claimed in claim 1, wherein, in formula (I),

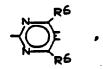
A denotes a radical $> C(R^4)_2$ or $> C = C(R^5)_2$,

R1 denotes (C1-C4)alkyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen or

monosubstituted to disubstituted by (C₁-C₄)alkoxy,

R² denotes H, (C₁-C₄)alkyl or allyl, R³ denotes a radical of the formula

25



30

35

40

radicals independently of one another denote H, or (C_1-C_6) alkyl which can optionally be monosubstituted or polysubstituted by halogen or monosubstituted to disubstituted by (C_1-C_4) alkoxy or (C_1-C_4) alkylthio, or a radical R⁴ denotes (C_2-C_6) alkenyl or phenyl which can be monosubstituted or polysubstituted by halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkoxy, NO_2 or CF_3 , and the other radical R⁴ denotes hydrogen,

the R⁵

the R4

radicals independently of one another denote H, or (C_1-C_6) alkyl, which can optionally be monosubstituted or polysubstituted by halogen,

the R⁶ ra

radicals independently of one another denote halogen, (C_1-C_4) alkyl or (C_1-C_4) alkoxy, both of which can be halogenated,

Е

denotes CH or N,

X denotes O, S or NR¹²,

Y denotes O or S and

 R^{12} denotes H, (C_1-C_4) alkyl or (C_2-C_4) alkenyl.

- The process as claimed in claim 1 or 2, wherein one radical R⁴ is (C₁-C₄)-alkyl or is phenyl which is monosubstituted to trisubstituted by fluorine, chlorine, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkyl or nitro, and the other radical R⁴ is hydrogen.
- 4. The process as claimed in one of claims 1 to 3, wherein R' denotes (C_1-C_4) -alkyl and R² denotes by hydrogen.
 - The process as claimed in one of claims 1 to 4, wherein R⁶ denotes CH₃, OCH₃, OCH₂H₅, CI or OCF₂H.
- 6. The use of a compound of the formula I as defined in one of claims 1 to 5, a stereoisomer or a salt thereof as a herbicide or plant growth regulator.

- 7. A method of controlling noxious plants, which comprises applying an effective amount of a compound of the formula I as defined in one of claims 1 to 5 or a stereoisomer or a salt thereof to these noxious plants or the soils which are used in agriculture or industry.
- 8. A method of regulating the growth of crop plants, which comprises applying an effective amount of a compound of the formula I as defined in one of claims 1 to 5 or a stereoisomer or a salt thereof to these crop plants or the cropped area.

Revendications

15

20

25

30

55

Revendications pour les Etats contractants suivants : AT, BE, CH, DE, FR, GB, IT, LI, NL, SE

1. Composés de formule (I)

dans laquelle

A est un résidu de formule $> C(R^4)_2$ ou $> C = C(R^5)_2$,

 R^1 est H ou un radical alkyle en C_1 - C_8 , alcényle en C_2 - C_8 , alcynyle en C_2 - C_8 , ces résidus aliphatiques pouvant être une ou plusieurs fois substitués par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_6 , alcényloxy en C_2 - C_6 , alcynyloxy en C_2 - C_6 , alkylsulfinyle en C_1 - C_6 , alkylsulfinyle en C_1 - C_6 , (alcoxy en C_1 - C_6)carbonyle, ou par des substituants phényle ; un radical cycloalkyle en C_3 - C_8 , pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ou alkylthio en C_1 - C_4 ; cycloalcényle en C_5 - C_8 , cyclopropylméthyle, époxypropyle, furfuryle, tétrahydrofurfuryle, phénoxy-(alkyle en C_1 - C_6) ou phényle, qui tous les deux peuvent être substitués dans le noyau phényle par des substituants halogéno, alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , ou NO_2 ,

 R^2 est H ou un radical alkyle en C_1 - C_8 , alcényle en C_2 - C_8 , alcynyle en C_2 - C_8 ou alcoxy en C_1 - C_4 , R^3 est un résidu de formule :

les radicaux R^4 , indépendamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , alcényle en C_2 - C_6 , alcynyle en C_2 - C_6 , cycloalkyle en C_3 - C_8 , les radicaux carbonés mentionnés ci-dessus pouvant être substitués une ou plusieurs fois par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_6 , alcényloxy en C_2 - C_6 , alcynyloxy en C_2 - C_6 , alkylsulfinyle en C_1 - C_6 , alkylsulfonyle en C_1 - C_6 ou (alcoxy en C_1 - C_6)carbonyle, ou encore par un radical

phényle pouvant être lui-même substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou des substituants alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4) carbonyle ou NO_2 , et de plus l'un des deux radicaux R^4 est un radical phényle pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou des radicaux alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , NO_2 ou CF_3 ,

les radicaux R^5 , indépendamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , qui peut être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_6 , alkylthio en C_1 - C_6 , alkylsulfinyle en C_1 - C_6 (alcoxy en C_1 - C_6) carbonyle, ou encore l'un des radicaux R^5 est un radical phényle pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des radicaux halogéno, alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , NO_2 , CF_3 (alcoxy en C_1 - C_6) carbonyle ou encore les deux radicaux R^5 forment ensemble un radical alkylène -(CH_2) $_0$ -,

les radicaux R^6 , indépendamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un halogène, un radical alkyle en C_1 - C_6 , alcoxy en C_1 - C_6 , ou alkylthio en C_1 - C_6 , pouvant être substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ou alkylthio en C_1 - C_4 ; un radical $N(R^{11})_2$, cycloalkyle en C_3 - C_6 , -CHR 7 COOR 11 , alcényle en C_3 - C_5 , alcynyle en C_2 - C_4 , alcényloxy en C_3 - C_5 ou alcynyloxy en C_3 - C_5 ,

R7 est H ou un radical alkyle en C1-C4,

R8 est un radical alkyle en C₁-C₄, -CHF₂ ou -CH₂CF₃,

R⁹, indépendamment l'un de l'autre, représente H ou un radical alkyle en C₁-C₄, alcoxy en C₁-C₄ ou halogéno.

R¹⁰ est H ou un radical alkyle en C₁-C₄, -CHF₂ ou -CH₂CF₃,

les radicaux R^{11} , indépendamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_4 , alcényle en C_2 - C_4 ou alcynyle en C_3 - C_4 ,

E est CH ou N,

G est CH2 ou O,

X est O, S ou NR12,

Y est O ou S,

 R^{12} est H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , alcényle en C_2 - C_6 , alcynyle en C_2 - C_6 , alcoxy en C_1 - C_6 , ou un résidu de formule

30

5

10

15

20

25

35

40

45

n est un nombre entier de 3 à 6,

p est un nombre entier de 1 à 3,

q est un nombre entier de 0 à 3,

z est O, S, CH2, NH ou N(alkyle en C1-C4), ou leurs sels pouvant être utilisés en agriculture.

 Composés de formule (I) selon la revendication 1, caractérisés en ce que A est un résidu de formule >C(R⁴)₂ ou >C = C(R⁵)₂,

 R^1 est un radical alkyle en C_1 - C_4 , pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ,

 R^2 est H ou un radical alkyle en $\mathsf{C}_1\text{-}\mathsf{C}_4$, ou allyle,

R3 est un radical de formule

50

55

les radicaux R⁴, indépendamment l'un de l'autre, sont chacun H ou un radical alkyle en C₁-C₆, pouvant être éventuellement substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou une ou deux fois par

des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ou alkylthio en C_1 - C_4 , ou encore un radical R^4 est un radical alcényle en C_2 - C_6 ou phényle, qui peut être substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou des radicaux alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , NO_2 ou CF_3 , en particulier, un radical R^4 est un radical alkyle en C_1 - C_4 ou phényle, et l'autre radical R^4 est un hydrogéne,

les radicaux R^5 , indépendamment l'un de l'autre, sont chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , qui peut être éventuellement une ou plusieurs fois substitué par des halogènes,

les radicaux R^6 , indépendamment l'un de l'autre, sont chacun un halogène ou un radical alkyle en C_1 - C_4 oualcoxy en C_1 - C_4 , qui tous les deux peuvent être halogénés,

E est CH ou N,

5

10

20

35

X est O, S ou NR12,

Y est O ou S, et

R12 est H ou un radical alkyle en C1-C4 ou alcényle en C2-C4.

- 3. Composés selon les revendications 1 ou 2, caractérisés en ce qu'un radical R⁴ est un radical alkyle en C₁-C₄ ou le radical phényle, substitué une à trois fois par des substituants fluoro, chloro, alcoxy en C₁-C₄, alkyle en C₁-C₄ ou nitro, et l'autre radical R⁴ est un hydrogène.
 - Composés selon l'une des revendications 1 à 3, caractérisés en ce que R¹ est un radical alkyle en C₁-C₄ et R² est un hydrogène.
 - Composés selon l'une des revendications 1 à 4, caractérisés en ce que R⁶ est CH₃, OCH₃, OC₂H₅, CI ou OCF₂H.
- 6. Procédé pour préparer les composés de formule (I) selon la revendication (I) ou leurs sels, caractérisé en ce que
 - a) on fait réagir un composé de formule (II)

dans laquelle A, X, Y et R¹ ont les significations données ci-dessus, sauf que R¹ est différent de H et X est différent de NH, avec un composé de formule (III)

b) on fait réagir un composé de formule (IV)

avec un (thio)-carbamate de formule (V)

où R¹³ est un radical alkyle en C₁-C₆, halogénalkyle en C₁-C₄ ou phényle, pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou des substituants alkyle en C₁-C₄ ou NO₂, c) on fait réagir un (thio)-carbamate de formule (VI) avec un composé de formule (III)

5

10

dans laquelle R¹³ a les significations données ci-dessus, ou bien d) on fait réagir un acide carboxylique de formule (VII)

15

20

25

avec un réactif d'alkylation de formule (VIII)

R¹-X (VIII)

où X est un groupe éliminable nucléofuge, tel par exemple un groupe halogéno, alkyl-SO₂-O- ou tosyle, et on convertit éventuellement les composés ainsi obtenus en leurs sels.

- 7. Herbicides ou agents régulateurs de croissance des végétaux, caractérisés en ce qu'ils contiennent une quantité efficace d'un composé de formule (I) selon l'une des revendications 1 à 5, de leurs stéréoisomères ou de leurs sels, et d'adjuvants inertes.
- 8. Utilisation des composés de formule (I) selon l'une des revendications 1 à 5, de leurs stéréo-isomères ou de leurs sels, comme herbicides ou régulateurs de croissance des végétaux.
 - 9. Procédé pour lutter contre les plantes nuisibles, caractérisé en ce qu'on applique sur ces dernières ou sur les sols à utilisation agricole ou industrielle, une quantité efficace d'un composé défini dans l'une des revendications 1 à 5, de formule (I) ou de leurs stéréoisomères ou de leurs sels.

40

10. Procédé de régulation de la croissance de plantes utiles, caractérisé en ce qu'on applique sur ces dernières, ou sur la surface de culture, une quantité efficace d'un composé de formule (I) selon l'une des revendications 1 à 5, ou de leurs stéréo-isomères, ou de leurs sels.

45 Revendications pour l'Etat contractant suivant : ES

1. Procédé pour préparer des composés de formule (I)

50

55

dans laquelle

A est un résidu de formule $> C(R^4)_2$ ou $> C = C(R^5)_2$,

R1 est H ou un radical alkyle en C1-C8, alcényle en C2-C8, alcynyle en C2-C8, ses résidus

aliphatiques pouvant être une ou plusieurs fois substitués par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_6 , alcényloxy en C_2 - C_6 , alcynyloxy en C_2 - C_6 , alkylsulfinyle en C_1 - C_6 , alkylsulfonyle en C_1 - C_6 , (alcoxy en C_1 - C_6) carbonyle, ou par des substituants phényle ; un radical cycloalkyle en C_3 - C_8 , pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ou alkylthio en C_1 - C_4 ; cycloalcényle en C_5 - C_8 , cyclopropylméthyle, époxypropyle, furfuryle, tétrahydrofurfuryle, phénoxy-(alkyle en C_1 - C_6) ou phényle, qui tous les deux peuvent être substitués dans le noyau phényle par des substituants halogéno, alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , ou NO_2 ,

 R^2 est H ou un radical alkyle en C_1 - C_8 , alcényle en C_2 - C_8 , alcynyle en C_2 - C_8 ou alcoxy en C_1 - C_4 , R^3 est un résidu de formule :

30

35

40

45

50

55

5

10

les radicaux R^4 , independamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , alcényle en C_2 - C_6 , alcynyle en C_2 - C_6 , cycloalkyle en C_3 - C_8 , les radicaux carbonés mentionnés ci-dessus pouvant être substitués une ou plusieurs fois par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_6 , alcényloxy en C_2 - C_6 , alcynyloxy en C_2 - C_6 , alkylthio en C_1 - C_6 , alkylsulfinyle en C_1 - C_6 , alkylsulfionyle en C_1 - C_6 ou (alcoxy en C_1 - C_6) carbonyle, ou encore par un radical phényle pouvant être lui-même substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou des substituants alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , carbonyle ou NO_2 , et de plus l'un des deux radicaux R^4 est un radical phényle pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou des radicaux alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , NO_2 ou CF_3 ,

les radicaux R^5 , indépendamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , qui peut être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_6 , alkylthio en C_1 - C_6 , alkylsulfinyle en C_1 - C_6 (alcoxy en C_1 - C_6)carbonyle, ou encore l'un des radicaux R^5 est un radical phényle pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des radicaux halogéno, alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , NO_2 , CF_3 (alcoxy en C_1 - C_6)carbonyle ou encore les deux radicaux R^5 forment ensemble un radical alkylène -(CH_2) $_0$ -,

les radicaux R^6 , indépendamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un halogène, un radical alkyle en C_1 - C_6 , alcoxy en C_1 - C_6 , ou alkylthio en C_1 - C_6 , pouvant être substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ou alkylthio en C_1 - C_4 ; un radical $N(R^{11})_2$, cycloalkyle en C_3 - C_6 , -CHR 7 COOR 11 , alcényle en C_3 - C_5 , alcynyle en C_2 - C_4 , alcényloxy en C_3 - C_5 ou alcynyloxy en C_3 - C_5 ,

R7 est H ou un radical alkyle en C1-C4,

R8 est un radical alkyle en C₁-C₄, -CHF₂ ou -CH₂CF₃,

R⁹, indépendamment l'un de l'autre, représente H ou un radical alkyle en C₁-C₄, alcoxy en C₁-C₄ ou halogéno,

 R^{10} est H ou un radical alkyle en $\mathsf{C}_1\text{-}\mathsf{C}_4$, $\mathsf{-CHF}_2$ ou $\mathsf{-CH}_2\mathsf{CF}_3$,

les radicaux R^{11} , indépendamment l'un de l'autre, représentent chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_4 , alcényle en C_2 - C_4 ou alcynyle en C_3 - C_4 ,

E est CH ou N,

G est CH2 ou O,

X est O, S ou NR12,

Y est O ou S,

5

10

20

25

30

35

45

55

R¹² est H ou un radical alkyle en C₁-C₆, alcényle en C₂-C₆, alcynyle en C₂-C₆, alcoxy en C₁-C₆, ou un résidu de formule

(CH₂)_p Z

n est un nombre entier de 3 à 6.

p est un nombre entier de 1 à 3,

q est un nombre entier de 0 à 3,

z est O, S, CH_2 , NH ou N(alkyle en $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4$), ou leurs sels pouvant être utilisés en agriculture, caractérisés en ce que

a) on fait réagir un composé de formule (II)

dans laquelle A, X, Y et R¹ ont les significations données ci-dessus, sauf que R¹ est différent de H et X est différent de NH, avec un composé de formule (III)

b) on fait réagir un composé de formule (IV)

$$\begin{array}{c} & & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & &$$

avec un (thio)-carbamate de formule (V)

$$\begin{array}{c} & & \text{Y} \\ \parallel & & \text{(V)} \\ \text{R13-O-C-N-R2} \end{array}$$

où R^{13} est un radical alkyle en C_1 - C_6 , halogénalkyle en C_1 - C_4 ou phényle, pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou des substituants alkyle en C_1 - C_4 ou NO_2 ,

c) on fait réagir un (thio)-carbamate de formule (VI) avec un composé de formule (III)

dans laquelle R¹³ a les significations données ci-dessus, ou bien d) on fait réagir un acide carboxylique de formule (VII)

avec un réactif d'alkylation de formule (VIII)

R1-X (VIII)

5

10

20

25

30

35

40

45

50

55

où X est un groupe éliminable nucléofuge, tel par exemple un groupe halogéno, alkyl-SO2-O- ou tosyle, et on convertit éventuellement les composés ainsi obtenus en leurs sels.

2. Procédé selon la revendication 1, caractérisé en ce que, dans la formule (I)

A est un résidu de formule $>C(R^4)_2$ ou $>C = C(R^5)_2$,

 R^1 est un radical alkyle en C_1 - C_4 , pouvant être une ou plusieurs fois substitué par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ,

R2 est H ou un radical alkyle en C1-C4, ou allyle,

R3 est un radical de formule

les radicaux R^4 , indépendamment l'un de l'autre, sont chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , pouvant être éventuellement substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou une ou deux fois par des substituants alcoxy en C_1 - C_4 ou alkylthio en C_1 - C_4 , ou encore un radical R^4 est un radical alcényle en C_2 - C_6 ou phényle, qui peut être substitué une ou plusieurs fois par des halogènes ou des radicaux alkyle en C_1 - C_4 , alcoxy en C_1 - C_4 , NO_2 ou CF_3 , en particulier, un radical R^4 est un radical alkyle en C_1 - C_4 ou phényle, et l'autre radical R^4 est un hydrogéne,

les radicaux R^5 , indépendamment l'un de l'autre, sont chacun H ou un radical alkyle en C_1 - C_6 , qui peut être éventuellement une ou plusieurs fois substitué par des halogènes,

les radicaux R^6 , indépendamment l'un de l'autre, sont chacun un halogéne ou un radical alkyle en C_1 - C_4 oualcoxy en C_1 - C_4 , qui tous les deux peuvent être halogénés,

E est CH ou N.

X est O, S ou NR12,

Y est O ou S, et

R12 est H ou un radical alkyle en C1-C4 ou alcényle en C2-C4.

Procédé selon les revendications 1 ou 2, caractérisé en ce qu'un radical R⁴ est un radical alkyle en C₁-C₄ ou le radical phényle, substitué à trois fois par des substituants fluoro, chloro, alcoxy en C₁-C₄,

alkyle en C₁-C₄ ou nitro, et l'autre radical R⁴ est un hydrogène.

- 4. Procédé selon l'une des revendications 1 à 3, caractérisé en ce que R¹ est un radical alkyle en C₁-C₄ et R² est un hydrogène.
- Procédé selon l'une des revendications 1 à 4, caractérisé en ce que R⁶ est CH₃, OCH₃, OC₂H₅, CI ou OCF₂H.
- 6. Utilisation des composés de formule (I) selon l'une des revendications 1 à 5, de leurs stéréo-isomères ou de leurs sels, comme herbicides ou régulateurs de croissance des végétaux.
 - 7. Procédé pour lutter contre les plantes nuisibles, caractérisé en ce qu'on applique sur ces dernières ou sur les sols à utilisation agricole ou industrielle, une quantité efficace d'un composé défini dans l'une des revendications 1 à 5, de formule (I) ou de leurs stéréoisomères ou de leurs sels.
 - 8. Procédé de régulation de la croissance de plantes utiles, caractérisé en ce qu'on applique sur ces dernières, ou sur la surface de culture, une quantité efficace d'un composé de formule (I) selon l'une des revendications 1 à 5, ou de leurs stéréo-isomères, ou de leurs sels.